# WELTORGANISATION FUR GEISTIGES EIGENTUM



# Internationales Büro INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation 7:

C07D 413/04, A01N 43/836, 47/06, 47/10, 47/28

WO 00/35913 (11) Internationale Veröffentlichungsnummer:

(43) Internationales

Veröffentlichungsdatum:

22. Juni 2000 (22.06.00)

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP99/09684

A1

(22) Internationales Anmeldedatum: 9. Dezember 1999 (09.12.99)

(30) Prioritätsdaten:

198 58 193.9

17. Dezember 1998 (17.12.98)

(71) Anmelder: AVENTIS CROPSCIENCE GMBH [DE/DE]; Miraustrasse 54, D-13509 Berlin (DE).

(72) Erfinder: HARMSEN, Sven; Merkurstrasse 36, D-23562 Lübeck (DE). BASTIAANS, Henricus, Maria, Martinus; Stockheimer Weg 9a, D-61250 Usingen (DE). SCHAPER, Wolfgang; Kapellenweg 5c, D-86420 Diedorf (DE). TIEBES, Jörg; Prieststrasse 15, D-60320 Frankfurt (DE). DÖLLER, Uwe; Rembrandtring 24a, D-63110 Rodgau (DE). JANS, Daniela; Schöne Aussicht 11, D-61348 Bad Homburg v. d. H. (DE). SANFT, Ulrich; Am Vogelgesang 7g, D-65817 Eppstein/Ts (DE). HEMPEL, Waltraut; Zum Morgengraben 18, D-65835 Liederbach (DE). THÖNESSEN, Maria-Theresia; Frauenlobstrasse 10, D-55262 Heidesheim (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AE, AL, AM, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CN, CR, CU, CZ, DM, EE, GD, GE, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LT, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MX, NO, NZ, PL, RO, RU, SG, SI, SK, TJ, TM, TR, TT, UA, UZ, VN, YU, ZA, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

#### Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

(54) Title: 4-TRIFLUOROMETHYL-3-OXADIAZOLYL PYRIDINES, METHODS FOR THE PRODUCTION THEREOF, AGENTS CONTAINING THESE COMPOUNDS, AND THEIR USE AS PESTICIDES

(54) Bezeichnung: 4-TRIFLUORMETHYL-3-OXADIAZOLYLPYRIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG, SIE EN-THALTENDE MITTEL UND IHRE VERWENDUNG ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL

**(I)** 

### (57) Abstract

The invention relates to 4-trifluoromethyl-3-oxadiazolyl pyridines of general formula (I), to methods for the production thereof, to agents containing the inventive compounds, and to the use of these compounds for combating animal pests, especially insects, red spiders, ectoparasites and parasitic helminths. X and Y have the meanings cited in the description.

#### (57) Zusammenfassung

Die vorliegende Erfindung betrifft 4-Trifluormethyl-3-oxadiazolylpyridine der allgemeinen Formel (I), Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie die Verwendung dieser Verbindungen zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnmilben, Ektoparasiten und Helminthen. X, Y haben die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen.

## LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien .	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakei
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Мопасо	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE.	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland		Republik Mazedonien	TR	Türkei
BG		HU	Ungam	ML	Mali	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Bulgarien Benin	IE	Irland	MN	Mongolei	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MR	Mauretanien	UG	Uganda
		IS	Island	MW	Malawi	US	Vereinigte Staaten von
BY	Belarus	IT	Italien	MX	Mexiko		Amerika
CA	Kanada	JP	Japan	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	KE	Kenia	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CG	Kongo	KG	Kirgisistan	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
СН	Schweiz	KP	Demokratische Volksrepublik	NZ	Neuseeland	zw	Zimbabwe
Cī	Côte d'Ivoire	KP	Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun			PT	·		
CN	China	KR	Republik Korea	RO	Portugal Rumānien		
CU	Kuba	KZ	Kasachstan		Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LC	St. Lucia	RU			
DE	Deutschland	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DK	Dānemark	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
EE	Estland	LR	Liberia	SG	Singapur		

1

#### Beschreibung

4-Trifluormethyl-3-oxadiazolylpyridine, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel

Die Erfindung betrifft 4-Trifluormethyl-3-oxadiazolylpyridine, Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnmilben, Ektoparasiten und Helminthen.

Es ist bereits bekannt, daß geeignet substituierte Pyridine akarizide und insektizide Wirkung zeigen. So sind in WO 95/07891 Pyridine beschrieben, die in 4-Position einen über ein Heteroatom verknüpften Cycloalkylrest und in 3-Position eine Gruppe unterschiedlicher Substituenten tragen. Jedoch ist die gewünschte Wirkung gegenüber den Schadorganismen nicht immer ausreichend. Darüber hinaus weisen diese Verbindungen oftmals unerwünschte toxikologische Eigenschaften gegenüber Säugetieren und aquatischen Lebewesen auf.

Aufgabe der vorliegenden Erfindung ist die Bereitstellung von Verbindungen mit guten insektiziden und akariziden Eigenschaften bei gleichzeitig geringer Toxizität gegenüber Säugetieren und aquatischen Lebewesen.

In der nicht vorveröffentlichten WO-A-98/57969 sind 4-Haloalkylpyridine und -pyrimidine zur Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel vorgeschlagen.

Es wurde nun gefunden, daß Verbindungen der allgemeinen Formel (I), gegebenenfalls auch als Salze, im Vergleich zu den bereits bekannten Verbindungen ein gutes Wirkungsspektrum gegenüber tierischen Schädlingen bei

gleichzeitig günstigeren toxikologischen Eigenschaften gegenüber Säugetieren und aquatischen Lebewesen aufweisen.

Gegenstand der Erfindung sind daher 4-Trifluormethyl-3-oxadiazolylpyridinderivate der Formel (I),

wobei die Symbole und Indizes folgende Bedeutungen haben:

m ist 0 oder 1;

X ist eine Einfachbindung, eine geradkettige Alkylengruppe mit 1, 2 oder 3 C-Atomen oder eine verzweigten Alkylengruppe mit 3 bis 9 C-Atomen, wobei ein oder mehrere H-Atome durch F ersetzt sein können;

Y ist -O-, -S-, -SO-, -SO<sub>2</sub>-, -O-CO-, -O-CO-O-, -SO<sub>2</sub>-O-, -O-SO<sub>2</sub>-, -NR<sup>1</sup>-, -NR<sup>2</sup>-CO-, -NR<sup>3</sup>-CO-O-, -NR<sup>4</sup>-CO-NR<sup>5</sup>-, -O-CO-CO-O-, -O-CO-NR<sup>6</sup>, -SO<sub>2</sub>-NR<sup>7</sup>, -NR<sup>8</sup>-SO<sub>2</sub>-;

R,R<sup>1</sup>,R<sup>2</sup>,R<sup>3</sup>,R<sup>4</sup>,R<sup>5</sup>,R<sup>6</sup>,R<sup>7</sup>,R<sup>8</sup> sind gleich oder verschieden, unabhängig voneinander H,  $(C_1-C_{10})\text{-Alkyl}, \ (C_2-C_{10})\text{-Alkenyl}, \ (C_2-C_{10})\text{-Alkinyl}, \ (C_3-C_8)\text{-Cycloalkyl}, \\ (C_4-C_8)\text{-Cycloalkenyl}, \ (C_6-C_8)\text{-Cycloalkinyl}, \ \text{Heterocyclyl},$  Heterocyclyl,

wobei jede der acht letztgenannten Gruppen gegebenenfalls ein oder mehrfach substituiert ist, und wobei gegebenenfalls jeweils R und R<sup>1</sup>, R und R<sup>2</sup>, R und R<sup>5</sup>, R und R<sup>6</sup>, R und R<sup>7</sup>, R und R<sup>8</sup> oder R und X zusammen auch ein Ringsystem bilden können;

mit der Maßgabe, daß die Verbindungen, in denen

$$X = -, Y = O, R = H$$

$$X = -$$
,  $Y = 0$ ,  $R = Me$ 

$$X = -$$
,  $Y = 0$ ,  $R = Et$ 

$$X = -$$
,  $Y = 0$ ,  $R = CHF2$ 

$$X = -$$
,  $Y = O$ ,  $R = CH2Ph$ 

$$X = CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = 2$ -Furanyl

$$X = CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = Me$ 

$$X = CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = 5$ -Isoxazolyl

$$X = CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = 5$ -Nitrolfuran-2-yl

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = H$ 

$$X = CH_2CH_2$$
;  $Y = O$ ,  $R = Me$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = CH_2$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = Et$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = H$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = OC(O)$ ,  $R = 4$ -F-phenyl

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = OC(O)$ ,  $R = 2,6$ -Difluorphenyl

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = OC(O)$ ,  $R = 4$ -Nitrophenyl

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = OC(O)$ ,  $R = t$ -Bu

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = OC(O)$ ,  $R = Cyclopropyl$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = OC(O)$ ,  $R = Me$ 

$$X = CH_2CH_2CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = H$ 

$$X = -$$
,  $Y = S(O)$ ,  $R = 4$ -Brombenzyl

$$X = CH_2$$
,  $Y = S$ ,  $R = Me$ 

$$X = CH_2$$
,  $Y = S(O)$ ,  $R = Me$ 

$$X = CH_2, Y = S(O)_2, R = t-Bu$$

$$X = CH_2$$
,  $Y = S$ ,  $R = 2$ -Thienyl

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = S$ ,  $R = Me$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = S$ ,  $R = n-Pr$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = S$ ,  $R = Benzyl$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = S$ ,  $R = 2$ -Thienyl-methyl

$$X = CH_2CH_2CH_2$$
,  $Y = S$ ,  $R = Me$ 

$$X = CH_2CH_2CH_2$$
,  $Y = S(O)$ ,  $R = Me$ 

4

 $X = CH_2CH_2CH_2CH_2$ , Y = S,  $R = CH_2CH_2CH_2CH_2OMe$  ausgenommen sind.

m ist vorzugsweise 0.

Ist m 1 und Y enthält eine S(O)<sub>n</sub>-Gruppe, so ist n vorzugweise 2.

- X ist vorzugsweise eine Einfachbindung, CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>, CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>) oder -CH<sub>2</sub>-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>-.
- Y ist vorzugsweise -O-, -S-, -SO-, -SO<sub>2</sub>-, -O-CO-, -O-CO-O, -O-CO-NR<sup>6</sup>-, -SO-NR<sup>7</sup>-, -O-SO<sub>2</sub>- oder -SO<sub>2</sub>-O-.
- R,R<sup>1</sup>,R<sup>2</sup>,R<sup>3</sup>,R<sup>4</sup>,R<sup>5</sup>,R<sup>6</sup>,R<sup>7</sup>,R<sup>8</sup> sind vorzugsweise gleich oder verschieden, unabhängig voneinander H,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkinyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl,  $(C_6-C_8)$ -Cycloalkinyl, Heterocyclyl,  $-(CH_2)_{1,4}$ -Heterocyclyl,

wobei die acht zuletzt genannten Reste gegebenenfalls mit einem oder mehreren Resten aus der Gruppe

Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, -C(=W)R9, (=W),

- $-C(=NOR^9)R^9$ ,  $-C(=NNR^9_2)R^9$ ,  $-C(=W)OR^9$ ,  $-C(=W)NR^9_2$ ,  $-OC(=W)R^9$ ,
- -OC(=W)OR9, -NR9C(=W)R9, -N[C(=W)R9]2, -NR9C(=W)OR9,
- -C(=W)NR9-NR92, -C(=W)NR9-NR9[C(=W)R9], -NR9-C(=W)NR92,
- -NR9-NR9C(=W)R9, -NR9-N[C(=W)R9]2, -N[(C=W)R9]-NR92,
- $-NR^9-N[(C=W)R^9]_{\scriptscriptstyle 2},\ -NR^9-NR^9[(C=W)WR^9],$
- -NR9-[(C=W)NR92], -NR9(C=NR9)R9, -NR9(C=NR9)NR92,
- -O-NR<sup>9</sup>,, -O-NR<sup>9</sup>(C=W)R<sup>9</sup>, -SO<sub>2</sub>NR<sup>9</sup>,, -NR<sup>9</sup>SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>, -SO<sub>2</sub>OR<sup>9</sup>, -OSO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>,
- -OR9, -NR92, -SR9, -SiR93, -SeR9, -PR92, -P(=W)R92,
- -SOR<sup>9</sup>, -SO<sub>2</sub>R<sup>9</sup>, -PW<sub>2</sub>R<sup>9</sup><sub>2</sub>, -PW<sub>3</sub>R<sup>9</sup><sub>2</sub>, Aryl und Heterocyclyl,

von denen die beiden letztgenannten Reste gegebenenfalls mit einem oder mehreren Resten aus der Gruppe

 $(C_1-C_6)$ -Alkyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkinyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl,  $(C_6-C_8)$ -Cycloalkinyl,  $(C_1-C_6)$ -Haloalkyl,

 $(C_2-C_6)$ -Haloalkenyl,  $(C_2-C_6)$ -Haloalkinyl, Halogen,  $-OR^{10}$ ,  $-NR^{10}_2$ ,  $-SR^{10}$ ,  $-SiR^{10}_3$ ,  $-C(=W)R^{10}$ ,  $-C(=W)OR^{10}$ ,  $-C(=W)NR^{10}_2$ ,  $-SO_2R^{10}$ , Nitro, Cyano und Hydroxy substituiert sind,

substituiert sind.

und wobei gegebenenfalls jeweils R und R¹, R und R², R und R⁵, R und R⁶, R und R⁶, R und R⁶, R und Rơ, R und Rơ oder R und X zusammen auch ein Ringsystem bilden können.

Bevorzugt zum Aufbau solcher Ringsysteme sind - $(CH_2)_3$ -, - $(CH_2)_4$ -, - $(CH_2)_5$ -, - $(CH_2)_2$ -O- $(CH_2)_2$ -, - $(CH_2)_2$ -NR³- $(CH_2)_2$ -, -(thiophen-3,4-diyl)-C(O)-, CH(imidazolyl-)CF $_2$ C(O)-, -CH(Me)CH $_2$ C(O)-, -CMe $_2$ CH $_2$ C(O)-, -CH(Me)CH(Me)C(O)-, -CH $_2$ CH $_2$ CH $_2$ C(O)-, -CH(Me)CH $_2$ CH $_3$ C(O)-, -CH $_4$ CH $_4$ CH $_4$ C(O)-, -CH $_4$ CH $_4$ CH $_4$ C(O)-, -CH $_4$ CH $_4$ CH $_5$ C(O)-, -CH $_4$ CH $_5$ C

W ist Ooder S.

R<sup>9</sup> ist Wasserstoff,

MICHAELD MICHAELT

 $(C_1-C_6)$ -Alkyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkinyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl- $(C_1-C_4)$ -Alkyl,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl- $(C_1-C_4)$ -Alkyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl- $(C_2-C_4)$ -Alkenyl,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl- $(C_1-C_4)$ -Alkenyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl- $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl- $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl- $(C_4-C_8)$ -Cycloalkyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl- $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl- $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl, wobei die vierzehn letztgenannten Reste gegebenenfalls mit einem oder mehreren Resten aus der Gruppe

Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Thio, Amino, Formyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkoxy,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyloxy,  $(C_2-C_6)$ -Alkinyloxy,  $(C_1-C_6)$ -Haloalkyloxy,  $(C_2-C_6)$ -

Haloalkenyloxy,  $(C_2-C_6)$ -Haloalkinyloxy,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkoxy,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Halocycloalkoxy, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Halocycloalkenyloxy,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl- $(C_1-C_4)$ -Alkoxy,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl- $(C_1-C_4)$ -Alkoxy,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl- $(C_2-C_4)$ -Alkenyloxy,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl- $(C_1-C_4)$ -Alkenyloxy,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl- $(C_3-C_8)$ -Cycloalkoxy,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl- $(C_3-C_8)$ -Cycloalkoxy,  $(C_2-C_6)$ -Alkinyl- $(C_3-C_8)$ -Cycloalkoxy,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl- $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyloxy, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl-(C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkoxy- $(C_1-C_6)$ -Alkoxy,  $(C_1-C_4)$ -Alkoxy- $(C_2-C_6)$ -Alkenyloxy, Carbamoyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Mono- oder Dialkylcarbamoyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Mono- oder Dihaloalkylcarbamoyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Mono- oder Dicycloalkylcarbamoyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkoxycarbonyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkoxycarbonyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkanoyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkanoyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkoxycarbonyl,  $(C_1-C_6)$ -Haloalkanoyloxy,  $(C_1-C_6)$ -Alkanamido,  $(C_1-C_6)$ -Haloalkanamido, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenamido, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkanamido, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl- $(C_1-C_4)$ -Alkanamido,  $(C_1-C_6)$ -Alkylthio,  $(C_2-C_6)$ -Alkenylthio,  $(C_2-C_6)$ -Alkinylthio,  $(C_1-C_6)$ -Haloalkylthio,  $(C_2-C_6)$ -Haloalkenylthio,  $(C_2-C_6)$ -Haloalkinylthio, (C₃-C₃)-Cycloalkylthio, (C₄-C₃)-Cycloalkenylthio, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Halocycloalkthio, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Halocycloalkenylthio, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl- $(C_1-C_4)$ -Alkylthio,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl- $(C_1-C_4)$ -Alkylthio,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl- $(C_2-C_4)$ -Alkenylthio,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl- $(C_1-C_4)$ -Alkenylthio,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl- $(C_3-C_8)$ -Cycloalkylthio,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl- $(C_3-C_8)$ -Cycloalkylthio,  $(C_2-C_6)$ -Alkinyl- $(C_3-C_8)$ -Cycloalkylthio,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl- $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenylthio,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl- $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenylthio,  $(C_1-C_6)$ -Alkylsulfinyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenylsulfinyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkinylsulfinyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkinylsulfinyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkylsulfinyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkinylsulfinyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkylsulfinyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkinylsulfinyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkinylsulfinyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkinylsulfinyl  $C_6$ )-Haloalkylsulfinyl,  $(C_2-C_6)$ -Haloalkenylsulfinyl,  $(C_2-C_6)$ -Haloalkinylsulfinyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkylsulfinyl, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenylsulfinyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Halocycloalksulfinyl, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Halocycloalkenylsulfinyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfinyl, (C<sub>4</sub>- $C_8$ )-Cycloalkenyl- $(C_1-C_4)$ -Alkylsulfinyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl- $(C_2-C_4)$ -Alkenylsulfinyl,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl- $(C_1-C_4)$ -Alkenylsulfinyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl- $(C_3-C_8)$ -Cycloalkylsulfinyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl- $(C_3-C_8)$ -

Cycloalkylsulfinyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkinyl- $(C_3-C_8)$ -Cycloalkylsulfinyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl- $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenylsulfinyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl- $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenylsulfonyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkinylsulfonyl,  $(C_1-C_6)$ -Haloalkylsulfonyl,  $(C_2-C_6)$ -Haloalkenylsulfonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkinylsulfonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkylsulfonyl, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenylsulfonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Halocycloalksulfonyl, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Halocycloalkenylsulfonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfonyl, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylsulfonyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl- $(C_2-C_4)$ -Alkenylsulfonyl,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl- $(C_1-C_4)$ -Alkenylsulfonyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl- $(C_3-C_8)$ -Cycloalkylsulfonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkylsulfonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinyl- $(C_3-C_8)$ -Cycloalkylsulfonyl,  $(C_1-C_8)$ -Alkyl- $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenylsulfonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl-(C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenylsulfonyl,  $(C_1-C_6)$ -Alkylamino,  $(C_2-C_6)$ -Alkenylamino,  $(C_2-C_6)$ -Alkinylamino,  $(C_1-C_6)$ -Haloalkylamino,  $(C_2-C_6)$ -Haloalkenylamino,  $(C_2-C_6)$ -Haloalkinylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkylamino, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Halocycloalkamino, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Halocycloalkenylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl- $(C_1-C_4)$ -Alkylamino,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl- $(C_1-C_4)$ -Alkylamino,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl- $(C_2-C_4)$ -Alkenylamino,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl- $(C_1-C_4)$ -Alkenylamino, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkylamino,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl- $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenylamino,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl- $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenylamino, (C1-C6)-Trialkylsilyl, Aryl, Aryloxy, Arylthio, Arylamino, Aryl- $(C_1-C_4)$ -Alkoxy, Aryl- $(C_2-C_4)$ -Alkenyloxy, Aryl- $(C_1-C_4)$ -Alkylthio, Aryl-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkenylthio, Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkylamino, Aryl-(C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkenylamino, Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Dialkylsilyl, Diaryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsilyl. Triarylsilyl und 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, wobei der cyclische Teil der vierzehn letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe Halogen, Cyano, Nitro, Amino, Hydroxy, Thio, (C1-C4)-Alkyl, (C1-C4)-Haloalkyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl,  $(C_1-C_4)$ -Alkoxy,  $(C_1-C_4)$ -Haloalkoxy,

 $(C_1-C_4)$ -Alkylthio,  $(C_1-C_4)$ -Haloalkylthio,  $(C_1-C_4)$ -Alkylamino,  $(C_1-C_4)$ -Haloalkylamino, Formyl und  $(C_1-C_4)$ -Alkanoyl substituiert ist,

substituiert sind.

Aryl, 4-, 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl,

wobei die beiden letztgenannten Reste gegebenenfalls durch einen oder mehrere Reste aus der Gruppe

Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Thio, Amino, Formyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxy,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyloxy,  $(C_2-C_6)$ -Alkinyloxy,  $(C_1-C_6)$ -Haloalkyloxy,  $(C_2-C_6)$ -Haloalkenyloxy,  $(C_2-C_6)$ -Haloalkinyloxy,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkoxy,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyloxy, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Halocycloalkoxy, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Halocycloalkenyloxy, Carbamoyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Mono- oder Dialkylcarbamoyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkanoyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Mone- oder Dihaloalkylcarbamoyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkoxycarbonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkanoyloxy, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkanamido, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkanamido, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenamido, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylthio, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenylthio, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinylthio,  $(C_1-C_6)$ -Haloalkylthio,  $(C_2-C_6)$ -Haloalkenylthio,  $(C_2-C_6)$ -Haloalkinylthio, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkylthio, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenylthio,  $(C_3-C_8)$ -Halocycloalkthio,  $(C_4-C_8)$ -Halocycloalkenylthio,  $(C_1-C_6)$ -Alkylsulfinyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenylsulfinyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkinylsulfinyl,  $(C_1-C_6)$ -Haloalkylsulfinyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkenylsulfinyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkinylsulfinyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkylsulfinyl,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenylsulfinyl,  $(C_3-C_8)$ -Halocycloalksulfinyl, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Halocycloalkenylsulfinyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylsulfonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenylsulfonyl, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkinylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkylsulfonyl, (C2-C6)-Haloalkenylsulfonyl, (C2-C6)-Haloalkinylsulfonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkylsulfonyl, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkenylsulfonyl, (C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Halocycloalksulfonyl, (C<sub>4</sub>-C<sub>8</sub>)-Halocycloalkenylsulfonyl, (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkenylamino, (C2-C6)-Alkinylamino, (C1-C6)-Haloalkylamino, (C2-C6)-

Haloalkenylamino, (C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>)-Haloalkinylamino, (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>)-Cycloalkylamino.

WO 00/35913 PCT/EP99/09684

9

 $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenylamino,  $(C_3-C_8)$ -Halocycloalkamino und  $(C_4-C_8)$ -Halocycloalkenylamino substituiert sind.

Besonders bevorzugt sind R, R¹-R³: H,  $(C_1-C_6)$ -Alkyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkenyl,  $(C_2-C_6)$ -Alkinyl, Heterocyclyl, wobei die vier letztgenannten Reste gegebenenfalls mit einem oder mehreren, vorzugsweise einem bis vier, Resten aus der Gruppe Halogen, vorzugsweise F, CN, SiMe<sub>3</sub>, -O- $(C_1-C_6)$ -Alkyl, -S- $(C_1-C_6)$ -Alkyl oder -O-CO- $(C_1-C_6)$ -Alkyl substituiert sind.

Ganz besonders bevorzugt sind Verbindungen der Formel I-1 bis I-32, auch in Form ihrer Pyridin-N-Oxide, wobei die Symbole und Indizes die oben angegebenen Bedeutungen haben:

WO 00/35913 PCT/EP99/09684

RNSDOCID: <WO 0035913A1 | >

WO 00/35913

PCT/EP99/09684

11

In gleicher Weise bevorzugt sind die entsprechenden Formeln I-33 bis I-96 in denen Y -CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH(CH<sub>3</sub>)-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>- und -CH<sub>2</sub>-C(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>- bedeutet.

Die Bezeichnung "Halogen" umfaßt Fluor, Chlor, Brom und lod.

Unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl" ist ein unverzweigter oder verzweigter Kohlenwasserstoffrest mit 1, 2, 3 oder 4 Kohlenstoffatomen, wie z.B. der Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, 1-Butyl-, 2-Butyl-, 2-Methylpropyl- oder tert.-Butylrest zu verstehen. Entsprechend ist unter Alkylresten mit einem größeren Bereich an Kohlenstoffatomen ein unverzweigter oder verzweigter gesättigter Kohlenwasserstoffrest zu verstehen, der eine Anzahl an Kohlenstoffatomen enthält, die dieser Bereichsangabe entspricht. Der Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkyl" umfaßt demnach die vorgenannten Alkylreste, sowie z.B. den Pentyl-, 2-Methylbutyl-, 1,1-Dimethylpropyl- oder Hexyl-Rest. Unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>)-Alkyl" sind die vorgenannten Alkylreste, sowie z.B. der Nonyl-, 1-Decyl- oder 2-Decyl-Rest zu verstehen.

Unter " $(C_1-C_4)$ -Haloalkyl" ist eine unter dem Ausdruck " $(C_1-C_4)$ -Alkyl" genannte Alkylgruppe zu verstehen, in der ein oder mehrere Wasserstoffatome durch die gleiche Anzahl gleicher oder verschiedener Halogenatome, bevorzugt Chlor oder Fluor, ersetzt sind, wie die Trifluormethyl-, die 1-Fluorethyl-, die 2,2,2-Trifluorethyl-, die Chlormethyl-, Fluormethyl-, die Difluormethyl- und die 1,1,2,2-Tetrafluorethylgruppe.

Unter " $(C_1-C_4)$ -Alkoxy" ist eine Alkoxygruppe zu verstehen, deren Kohlenwasserstoffrest die unter dem Ausdruck " $(C_1-C_4)$ -Alkyl" angegebene Bedeutung hat. Sinngemäß sind Alkoxygruppen zu verstehen, die einen größeren Bereich an Kohlenstoffatomen umfassen.

Die Bezeichnungen "Alkenyl" und "Alkinyl" mit einer vorangestellten Bereichsangabe von Kohlenstoffatomen bedeuten einen geradkettigen oder verzweigten Kohlenwasserstoffrest mit einer dieser Bereichsangabe entsprechenden Kohlenstoffatomzahl, der mindestens eine Mehrfachbindung beinhaltet, wobei sich diese an beliebiger Position des betreffenden ungesättigten Restes befinden kann. "(C2-C4)-Alkenyl" steht demnach z.B. für die Vinyl-, Allyl-, 2-Methyl-2-propen- oder 2-Butenyl-Gruppe; "(C2-C6)-Alkenyl" steht für die vorstehend genannten Reste sowie z.B. für die Pentenyl-, 2-Methylpentenyl- oder die Hexenyl-Gruppe. "(C2-C4)-Alkinyl" steht z.B. für die Ethinyl-, Propargyl-, 2-Methyl-2-propin- oder 2-Butinyl-Gruppe. Unter "(C2-C6)-Alkinyl" sind die vorstehend genannten Reste sowie z.B. die 2-Pentinyl- oder die 2-Hexinyl-Gruppe und unter "(C2-C10)-Alkinyl" die vorstehend genannten Reste sowie z.B. die 2-Octinyl- oder die 2-Decinyl-Gruppe zu verstehen.

"(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl" steht für monocyclische Alkylreste, wie den Cyclopropyl-, Cyclobutyl-, Cyclopentyl-, Cyclohexyl-, Cycloheptyl- oder Cyclooctylrest und für bicyclische Alkylreste, wie den Norbornylrest.

Unter dem Ausdruck " $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl- $(C_1-C_4)$ -alkyl " ist beispielsweise der Cyclopropylmethyl-, Cyclopentylmethyl-, Cyclohexylmethyl-, Cyclohexylethyl- und Cyclohexylbutyl-Rest und unter dem Ausdruck " $(C_1-C_6)$ -Alkyl- $(C_3-C_8)$ -cycloalkyl beispielsweise der 1-Methyl-cyclopropyl-, 1-Methyl-cyclopentyl-, 1-Methyl-cyclohexyl-, 3-Hexyl-cyclobutyl- und 4-tert.-Butyl-cyclohexyl-Rest zu verstehen.

" $(C_1-C_4)$ -Alkoxy- $(C_1-C_6)$ -alkyloxy" bedeutet eine wie vorstehend definierte Alkoxy-Gruppe, die durch eine weitere Alkoxy-Gruppe substituiert ist, wie z.B. 1-Ethoxy-ethoxy.

Unter " $(C_3-C_8)$ -Cycloalkoxy" oder " $(C_3-C_8)$ -Cycloalkylthio" ist einer der oben angeführten  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl-Reste, der über ein Sauerstoff- oder Schwefelatom verknüpft ist, zu verstehen.

"(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-Cycloalkyl-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-alkoxy" bedeutet z.B. die Cyclopropylmethoxy, Cyclobutylmethoxy-, Cyclopentylmethoxy-, Cyclohexylmethoxy-, Cyclohexylethoxy-oder die Cyclohexylbutoxy-Gruppe;

Der Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkyl-(C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>)-cycloalkoxy" steht z.B. für die Methylcyclopropyloxy-, Methylcyclobutyloxy- oder die Butylcyclohexyloxy-Gruppe.

" $(C_1-C_6)$ -Alkylthio" steht für eine Alkylthiogruppe, deren Kohlenwasserstoffrest die unter dem Ausdruck " $(C_1-C_6)$ -Alkyl" angegebene Bedeutung hat.

Analog bedeuten " $(C_1-C_6)$ -Alkylsulfinyl" z.B. die Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, Isobutyl-, sek.-Butyl- oder tert.-Butylsulfinyl-Gruppe und " $(C_1-C_6)$ -Alkylsulfonyl" z.B. die Methyl-, Ethyl-, Propyl-, Isopropyl-, Butyl-, Isobutyl-, sek.-Butyl- oder tert.-Butylsulfonyl-Gruppe.

"(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Alkylamino" steht für ein Stickstoffatom, das durch ein oder zwei, gleiche oder verschiedene Alkylreste der obigen Definition substituiert ist.

Der Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>)-Mono- oder Dialkylcarbamoyl" bedeutet eine Carbamoylgruppe mit einem oder zwei Kohlenwasserstoffresten, die die unter dem Ausdruck "(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl)" angegebene Bedeutung haben und die im Fall von zwei Kohlenwasserstoffresten gleich oder verschieden sein können.

Analog bedeutet " $(C_1-C_6)$ -Dihaloalkylcarbamoyl" eine Carbamoylgruppe, die zwei  $(C_1-C_6)$ -Haloalkylreste gemäß der obigen Definition oder einen  $(C_1-C_6)$ -Haloalkylrest und einen  $(C_1-C_6)$ -Alkylrest gemäß der obigen Definition trägt.

"(C₁-C₆)-Alkanoyl" steht z.B. für die Acetyl-, Propionyl-, Butyryl- oder 2-Methylbutyryl-Gruppe;

Unter dem Ausdruck "Aryl" ist ein carbocyclischer, d.h. aus Kohlenstoffatomen aufgebauter, aromatischer Rest mit vorzugsweise 6 bis 14, insbesondere 6 bis 12 C-Atomen, wie beispielsweise Phenyl, Naphthyl oder Biphenylyl, vorzugsweise Phenyl zu verstehen. "Aroyl" bedeutet demnach einen wie vorstehend definierter Arylrest, der über eine Carbonyl-Gruppe gebunden ist, wie z.B. die Benzoyl-Gruppe.

Der Ausdruck "Heterocyclyl" steht vorzugsweise für einen cyclischen Rest, der vollständig gesättigt, teilweise ungesättigt oder vollständig ungesättigt sein kann und der durch mindestens ein oder mehrere gleiche oder verschiedene Atome aus der Gruppe Stickstoff, Schwefel oder Sauerstoff unterbrochen sein kann, wobei jedoch nicht zwei Sauerstoffatome direkt benachbart sein dürfen und noch mindestens ein Kohlenstoffatom im Ring vorhanden sein muß, wie z.B. ein Rest von Thiophen. Furan, Pyrrol, Thiazol, Oxazol, Imidazol, Isothiazol, Isoxazol, Pyrazol, 1,3,4-Oxadiazol, 1,3,4-Thiadiazol, 1,3,4-Triazol, 1,2,4-Oxadiazol, 1,2,4-Thiadiazol, 1,2,4-Triazol, 1,2,3-Triazol, 1,2,3,4-Tetrazol, Benzo[b]thiophen, Benzo[b]furan, Indol. Benzo[c]thiophen, Benzo[c]furan, Isoindol, Benzoxazol, Benzothiazol, Benzimidazol, Benzisoxazol, Benzisothiazol, Benzopyrazol, Benzothiadiazol, Benzotriazol, Dibenzofuran, Dibenzothiophen, Carbazol, Pyridin, Pyrazin, Pyrimidin, Pyridazin, 1,3,5-Triazin, 1,2,4-Triazin, 1,2,4,5-Tetrazin, Chinolin, Isochinolin, Chinoxalin, Chinazolin, Cinnolin, 1,8-Naphthyridin, 1,5-Naphthyridin, 1,6-Naphthyridin, 1,7-Naphthyridin, Phthalazin, Pyridopyrimidin, Purin, Pteridin, 4H-Chinolizin, Piperidin, Pyrrolidin, Oxazolin, Tetrahydrofuran, Tetrahydropyran, Isoxzolidin oder Thiazolidin. Der Ausdruck "Heteroaromat" umfaßt demnach von den vorstehend

unter "Heterocycly" genannten Bedeutungen jeweils die vollständig ungesättigten aromatischen heterocyclischen Verbindungen.

Heterocyclyl bedeutet besonders bevorzugt ein gesättigtes, teilgesättigtes oder aromatisches Ringsystem mit 3 bis 6 Ringgliedern und 1 bis 4 Heteroatomen aus der Gruppe O, S und N, wobei mindestens ein Kohlenstoffatom im Ring vorhanden sein muß.

Ganz besonders bevorzugt bedeutet Heterocyclyl ein Radikal des Pyridin, Pyrimidin, (1,2,4)-Oxadiazol, (1,3,4)-Oxadiazol, Pyrrol, Furan, Thiophen, Oxazol, Thiazol, Imidazol, Pyrazol, Isoxazol, 1,2,4-Triazol, Tetrazol, Pyrazin, Pyridazin, Oxazolin, Thiazolin, Tetrahydrofuran, Tetrahydropyran, Morpholin, Piperidin, Piperazin, Pyrrolin, Pyrrolidin, Oxazolidin, Thiazolidin, Oxiran und Oxetan.

"Aryl- $(C_1-C_4)$ -alkoxy" steht für einen über eine  $(C_1-C_4)$ -Alkoxygruppe verknüpften Arylrest, z.B. den Benzyloxy-, Phenylethoxy-, Phenylbutoxy- oder Naphthylmethoxy-Rest.

"Arylthio" bedeutet einen über ein Schwefelatom verknüpften Arylrest, z.B. den Phenylthio- oder den 1- oder 2-Naphthylthio-Rest. Analog bedeutet "Aryloxy" z.B. den Phenoxy- oder 1- oder 2-Naphthyloxy-Rest.

"Aryl-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-alkylthio" steht für einen Arylrest, der über einen Alkylthiorest verknüpft ist, z.B. der Benzylthio-, Naphthylmethylthio- oder die Phenylethylthio-Rest.

Der Ausdruck " $(C_1-C_6)$ -Trialkylsilyl" bedeutet ein Siliciumatom, das drei gleiche oder verschiedene Alkylreste gemäß der obigen Definition trägt. Analog stehen "Aryl- $(C_1-C_6)$ -Dialkylsilyl" für ein Siliciumatom, das einen Arylrest und zwei gleiche oder verschiedene Alkylreste gemäß der obigen Definition trägt, "Diaryl- $(C_1-C_6)$ -Alkylsilyl" für ein Siliciumatom, das einen Alkylrest und zwei gleiche oder verschiedene

WO 00/35913 PCT/EP99/09684

17

Arylreste gemäß der obigen Definition trägt, und "Triarylsilyl" für ein Siliciumatom, das drei gleiche oder verschiedene Arylreste gemäß der obigen Definition trägt.

In den Fällen, in denen zwei oder mehrere Reste R<sup>9</sup> in einem Substituenten auftreten, wie z.B. bei -C(=W)NR<sup>9</sup><sub>2</sub>, können diese gleich oder verschieden sein.

Je nach Art der oben definierten Substituenten weisen die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) saure oder basische Eigenschaften auf und können Salze bilden. Tragen die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) beispielsweise Gruppen wie Hydroxy, Carboxy oder andere, saure Eigenschaften induzierende Gruppen, so können diese Verbindungen mit Basen zu Salzen umgesetzt werden. Geeignete Basen sind beispielsweise Hydroxide, Carbonate, Hydrogencarbonate der Alkaliund Erdalkalimetalle, insbesondere die von Natrium, Kalium, Magnesium und Calcium, weiterhin Ammoniak, primäre, sekundäre und tertiäre Amine mit (C,-C<sub>4</sub>)-Alkylresten sowie Mono-, Di- und Trialkanolamine von (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)-Alkanolen. Tragen die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) beispielsweise Gruppen wie Amino. Alkylamino oder andere, basische Eigenschaften induzierende Gruppen, so können diese Verbindungen mit Säuren zu Salzen umgesetzt werden. Geeignete Säuren sind beispielsweise Mineralsäuren, wie Salz-, Schwefel- und Phosphorsäure, organische Säuren, wie Essigsäure oder Oxalsäure, und saure Salze, wie NaHSO4 und KHSO<sub>4</sub>. Die so erhältlichen Salze weisen ebenfalls insektizide, akarizide und nematizide Eigenschaften auf.

Die Verbindungen der allgemeinen Formel (I) können ein oder mehrere asymmetrische Kohlenstoffatome oder Stereoisomere an Doppelbindungen aufweisen. Es können daher Enantiomere oder Diastereomere auftreten. Die Erfindung umfaßt sowohl die reinen Isomeren als auch deren Gemische. Die Gemische von Diastereomeren können nach gebräuchlichen Methoden, z.B. durch selektive Kristallisation aus geeigneten Lösungsmitteln oder durch Chromatographie in die Isomeren aufgetrennt werden. Racemate können nach üblichen Methoden in die Enantiomeren aufgetrennt werden.

Die Herstellung der erfindungsgemäßen Verbindungen erfolgt nach an sich literaturbekannten Methoden, wie sie in Standardwerken zur Organischen Synthese, z.B. Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Georg-Thieme-Verlag, Stuttgart, beschrieben werden.

Die Herstellung erfolgt dabei unter Reaktionsbedingungen, die für die genannten Umsetzungen bekannt und geeignet sind. Dabei kann man auch von an sich bekannten, hier nicht näher erwähnten Varianten Gebrauch machen.

Die Ausgangsstoffe können gewünschtenfalls auch in situ gebildet werden, und zwar derart, daß man sie aus dem Reaktionsgemisch nicht isoliert, sondern sofort weiter zu den Verbindungen der Formel (I) umsetzt.

Zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) setzt man z.B. aktivierte Derivate der Säure der allgemeinen Formel (II),

in Gegenwart einer Base mit einer Verbindung der Formel (III) um.

H<sub>2</sub>N 
$$X-Y-R$$

in welcher der Rest X-Y-R wie in Formel (I) definiert ist oder einer Vorstufe eines solchen Rests entspricht. Als aktiviertes Derivat kann beispielsweise ein Säurehalogenid, ein Ester oder ein Anhydrid eingesetzt werden. Als Basen eignen sich Amine, wie Triethylamin, Diisopropylethylamin, Pyridin oder Lutidin, Alkalimetallhydroxide, Alkalimetallalkoholate, wie Natriumethanolat oder Kalium-tertbutanolat, oder Alkylmetallverbindungen, wie Butyllithium.

Die beschriebene Reaktion kann je nach Wahl der Bedingungen als Einstufenprozeß oder als Zweistufenprozeß durchgeführt werden, wobei Verbindungen der Formel (IV) durchlaufen werden:

Verbindungen der Formel (IV) können durch Erhitzen in einem inerten Lösungsmittel zu den 1,2,4-Oxadiazolen bei Temperaturen bis zu 180°C sowie durch Zusatz wasserentziehender Reagentien (z.B. Amberlyst) cyclisiert werden.

Verbindungen der Formel (IV) sind auch direkt zugänglich aus der Säure der Formel (II) und Amidoximen der Formel (III) durch Verwendung eines wasserentziehenden Reagenzes wie Dicyclohexylcarbodiimid, 1-Ethyl-3-(3-dimethylaminopropyl)carbodiimid oder N,N'-Carbonyldiimidazol.

Sowohl 4-Trifluormethylnicotinsäure (II) wie auch Amidoxime der Formel (III) sind käuflich oder können nach literaturbekannten Verfahren hergestellt werden (siehe zum Beispiel: Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, Band X/4, Seite 209-212; EP-A 0 580 374; G.F. Holland, J.N. Pereira, J. Med. Chem., 1967, 10, 149).

Nach beendetem Aufbau der Oxadiazolylgruppe, die in der nachfolgenden Grafik beispielhaft aufgezeigt wird, durch z.B. Kondensations-, Cyclisierungs- oder Cycloadditionsreaktionen kann der Rest R noch gewünschtenfalls weiter derivatisiert werden, wobei die breite Methodenpalette der organisch-chemischen Synthese eingesetzt werden kann.

$$CF_3$$
 $CO_2Me$ 
 $HO-N$ 
 $NaOEt$ 
 $CF_3$ 
 $O-N$ 
 $N$ 

Als zentrale Intermediate von Ethern, Thioethern und analogen Derivaten dienen haloalkyl-, hydroxyalkyl- sowie aminoalkylsubstituierte Oxadiazol-Derivate der Formel (V),

die dann nach Standardverfahren der organischen Synthese in die entsprechenden Zielverbindungen umgewandelt werden können.

Ether der Formel (I) sind durch Veretherung entsprechender Hydroxyverbindungen erhältlich, wobei die Hydroxyverbindung zweckmäßig zunächst in ein entsprechendes Metallderivat, z.B. durch Behandeln mit NaH, NaNH<sub>2</sub>, NaOH, KOH, Na<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> in das entsprechende Alkalimetallalkoholat übergeführt wird. Dieses kann dann mit dem entsprechenden Alkylhalogenid, Alkylsulfonat oder Dialkylsulfat umgesetzt werden, zweckmäßig in einem inertem Lösungsmittel, wie Aceton, 1,2-Dimethoxyethan, DMF oder Dimethylsulfoxid, oder auch mit einem Überschuß an wäßriger oder wäßrig-alkoholischer NaOH oder KOH bei Temperaturen zwischen etwa 20°C und 100°C.

Derivate der Aminoverbindung (VI) können beispielsweise durch Reaktion der Chlorverbindung ((V), V = CI) mit Aminen

oder über das zentrale Intermediat ((V);  $V = NH_2$ ) hergestellt werden. Der Aufbau des zentralen Intermediats ((V);  $V = NH_2$ ) gelingt entweder durch Umsetzung des Chlorderivats ((V); V = CI) mit Ammoniak in Gegenwart einer geeigneten Base oder besser durch Reaktion desselben Chlorderivats ((V); V = CI) mit Kaliumphthalimid und anschließender Hydrazinolyse. Die weitere Derivatisierung dieses zentralen Intermediats ((V);  $V = NH_2$ ) erfolgt durch Umsetzung mit geeigneten Elektrophilen.

Zur Herstellung der Sulfoxide ((VII); n =1) und der Sulfone ((VII); n=2) verwendet man beispielsweise die entsprechenden Thioether der allgemeinen Formel (VII); n=0):

Die Synthese gelingt durch Oxidation mit einem Oxidationsmittel, wie z.B. meta-Chlorperbenzoesäure, durch geeignete Wahl von Stöchiometrie und Temperatur.

Die Synthese der Esteralkyl-substituierten Oxadiazol-Derivate (VIII) gelingt beispielsweise durch Substitution von Chlor in ((V); V = CI) mit Alkalicarboxylaten oder durch Veresterung des Hydroxyalkyloxadiazols ((V); V = OH) mit aktivierten Carbonsäurederivaten.

Aus dem Hydroxyalkyloxadiazol ((V); V = OH) lassen sich auf analoge Weise auch die entsprechenden Sulfonate generieren.

Zur Darstellung der Sulfonamide (X) wird die Chloralkylverbindung ((V); V = Cl) mit Natriumsulfit in das entsprechende Natriumsulfonat (IX) überführt, das dann seinerseits zu dem angestrebten Sulfonamid (X) weiter derivatisiert werden kann.

Kollektionen aus Verbindungen der Formel (I), die nach oben genannten Schema synthetisiert werden können, können auch in parallelisierter Weise hergestellt werden, wobei dies in manueller, teilweise automatisierter oder vollständig automatisierter Weise geschehen kann. Dabei ist es beispielsweise möglich, die Reaktionsdurchführung, die Aufarbeitung oder die Reinigung der Produkte bzw. Zwischenstufen zu automatisieren. Insgesamt wird hierunter eine Vorgehensweise verstanden, wie sie beispielsweise durch S.H. DeWitt in "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", Band 1, Verlag Escom 1997, Seite 69 bis 77 beschrieben ist.

Zur parallelisierten Reaktionsdurchführung und Aufarbeitung können eine Reihe von im Handel erhältlichen Geräten verwendet werden, wie sie beispielsweise von den Firmen Stem Corporation, Woodrolfe road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, England oder H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Deutschland oder der Firma Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, England, angeboten werden. Für die parallelisierte Aufreinigung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) beziehungsweise von bei der Herstellung anfallenden Zwischenprodukten stehen unter anderem Chromatographieapparaturen zur Verfügung, beispielsweise der Firma ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, USA.

Die aufgeführten Apparaturen führen zu einer modularen Vorgehensweise, bei der die einzelnen Arbeitsschritte automatisiert sind, zwischen den Arbeitsschritten jedoch manuelle Operationen durchgeführt werden müssen. Dies kann durch den Einsatz von teilweise oder vollständige integrierten Automationssystemen umgangen werden, bei denen die jeweiligen Automationsmodule beispielsweise durch Roboter bedient werden. Derartige Automationssysteme können zum Beispiel von der Firma Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, USA bezogen werden.

Neben den hier beschriebenen kann die Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) vollständig oder partiell durch Festphasen - unterstützte - Methoden erfolgen. Zu diesem Zweck werden einzelne Zwischenstufen oder alle Zwischenstufen der Synthese oder einer für die entsprechende Vorgehensweise angepaßten Synthese an ein Syntheseharz gebunden. Festphasen – unterstützte - Synthesemethoden sind in der Fachliteratur hinreichend beschrieben, z.B. Barry A. Bunin in "The Combinatorial Index", Verlag Academic Press, 1998.

Die Verwendung von Festphasen unterstützten Synthesemethoden erlaubt eine Reihe von literaturbekannten Protokollen, die wiederum manuell oder automatisierten ausgeführt werden können. Zum Beispiel kann die

"Teebeutelmethode" (Houghten, US 4,631,211; Houghten et al., Proc. Natl. Acad. Sci, 1985, 82, 5131-5135) mit Produkten der Firma IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, USA teilweise automatisiert werden. Die Automatisierung von Festphasen unterstützten Parallelsynthesen gelingt beispielsweise durch Apparaturen der Firmen Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, USA oder MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Deutschland.

Die Herstellung gemäß der hier beschriebenen Verfahren liefert Verbindungen der Formel (I) in Form von Substanzkollektionen, die Bibliotheken genannt werden. Gegenstand der vorliegenden Erfindung sind auch Bibliotheken, die mindestens zwei Verbindungen der Formel (I) enthalten.

Die Verbindungen der Formel (I) eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblütertoxizität zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren, Helminthen und Mollusken, ganz besonders bevorzugt zur Bekämpfung von Insekten und Spinnentieren, die in der Landwirtschaft, bei der Tierzucht, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie sind gegen normal sensible und resistente Arten sowie alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

Aus der Ordnung der Acarina z.B. Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptruta oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp., Eotetranychus spp., Oligonychus spp., Eutetranychus spp.. Aus der Ordnung der Isopoda z.B. Oniscus aselus, Armadium vulgare, Porcellio scaber.

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. Blaniulus guttulatus.

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. Geophilus carpophagus, Scutigera spp..

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. Scutigerella immaculata.

27

Aus der Ordnung der Thysanura z.B. Lepisma saccharina.

Aus der Ordnung der Collembola z.B. Onychiurus armatus.

Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Leucophaea maderae, Blattella germanica, Acheta domesticus, Gryllotalpa spp., Locusta migratoria migratorioides, Melanoplus differentialis, Schistocerca gregaria. Aus der Ordnung des Isoptera z.B. Reticulitermes spp..

Aus der Ordnung der Anoplura z.B. Phylloera vastatrix, Pemphigus spp., Pediculus humanus corporis, Haematopinus spp., Linognathus spp..

Aus der Ordnung der Mallophaga z.B. Trichodectes pp., Damalinea spp..

Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. Hercinothrips femoralis, Thrips tabaci.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. Eurygaster spp., Dysdercus intermedius, Piesma quadrata, Cimex lectularius, Rhodnius prolixus, Triatoma spp..

Aus der Ordnung der Homoptera z.B. Aleurodes brassicae, Bemisia tabaci, Trialeurodes vaporariorum, Aphis gossypii, Brevicoryne brassicae, Cryptomyzus ribis, Doralis fabae, Doralis pomi, Eriosoma lanigerum, Hyalopterus arundinis, Macrosiphum avenae, Myzus spp., Phorodon humuli, Rhopalosiphum padi, Empoasca spp., Euscelus bilobatus, Nephotettix cincticeps, Lecanium corni, Saissetia oleae, Laodelphax striatellus, Nilaparvata lugens, Aonidiella aurantii, Aspidiotus hederae, Pseudococcus spp., Psylla spp..

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. Pectinophora gossypiella, Bupalus piniarius, Cheimatobia brumata, Lithocolletis blancardella, Hyponomeuta padella, Plutella maculipennis, Malacosoma neustria, Euproctis chrysorrhoea, Lymantria spp., Bucculatrix thurberiella, Phyllocnistis citrella, Agrotis spp., Euxoa spp., Feltia spp., Earias insulana, Heliothis spp., Laphygma exigua, Mamestra brassicae, Panolis flammea, Prodenia litura, Spodoptera spp., Trichoplusia ni, Carpocapsa pomonella, Pieris spp., Chilo spp., Pyrausta nubilalis, Ephestia kuehniella, Galleria mellonella, Cacoecia podana, Capua reticulana, Choristoneura fumiferana, Clysia ambiguella, Homona magnanima, Tortrix viridana.

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. Anobium punctatum, Rhizopertha dominica, Bruchidius obtectus, Acanthoscelides obtectus, Hylotrupes bajulus, Agelastica alni,

Leptinotarsa decemlineata, Phaedon cochleariae, Diabrotica spp., Psylloides chrysocephala, Epilachna varivestis, Atomaria spp., Oryzaephilus surinamensis, Anthonomus spp., Sitophilus spp., Otiorrhynchus sulcatus, Cosmopolites sordidus, Ceuthorrynchus assimilis, Hypera postica, Dermestes spp., Trogoderma, Anthrenus spp., Attagenus spp., Lyctus spp., Meligethes aeneus, Ptinus spp., Niptus hololeucus, Gibbium psylloides, Tribolium spp., Tenebrio molitor, Agriotes spp., Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica.

Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp..

Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hypobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa.

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Xenopsylla cheopsis, Ceratophyllus spp.. Aus der Ordnung der Arachnida z.B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans. Aus der Klasse der Helminthen z.B. Haemonchus, Trichostrongulus, Ostertagia, Cooperia, Chabertia, Strongyloides, Oesophagostomum, Hyostrongulus, Ancylostoma, Ascaris und Heterakis sowie Fasciola.

Aus der Klasse der Gastropoda z.B. Deroceras spp., Arion spp., Lymnaea spp., Galba spp., Succinea spp., Biomphalaria spp., Bulinus spp., Oncomelania spp.. Aus der Klasse der Bivalva z.B. Dreissena spp..

Zu den pflanzenparasitären Nematoden, die erfindungsgemäß bekämpft werden können, gehören beispielsweise die wurzelparasitären Bodennematoden wie z.B. solche der Gattungen Meloidogyne (Wurzelgallennematoden, wie Meloidogyne incognita, Meloidogyne hapla und Meloidogyne javanica), Heterodera und

WO 00/35913 PCT/EP99/09684

29

Globodera (zystenbildende Nematoden, wie Globodera rostochiensis, Globodera pallida, Heterodera trifolii) sowie der Gattungen Radopholus wie Radopholus similis, Pratylenchus wie Pratyglenchus neglectus, Pratylenchus penetrans und Pratylenchus curvitatus;

Tylenchulus wie Tylenchulus semipenetrans, Tylenchorhynchus, wie Tylenchorhynchus dubius und Tylenchorhynchus claytoni, Rotylenchus wie Rotylenchus robustus, Heliocotylenchus wie Haliocotylenchus multicinctus, Belonoaimus wie Belonoaimus longicaudatus, Longidorus wie Longidorus elongatus, Trichodorus wie Trichodorus primitivus und Xiphinema wie Xiphinema index.

Ferner lassen sich mit den erfindungsgemäßen Verbindungen die Nematodengattungen Ditylenchus (Stengelparasiten, wie Ditylenchus dipsaci und Ditylenchus destructor), Aphelenchoides (Blattnematoden, wie Aphelenchoides ritzemabosi) und Anguina (Blütennematoden, wie Anguina tritici) bekämpfen.

Die Erfindung betrifft auch Mittel, beispielsweise Pflanzenschutzmittel, vorzugsweise insektizide, akarizide, ixodizide, nematizide, molluskizide oder fungizide, besonders bevorzugt insektizide und akarizide Mittel, die eine oder mehrere Verbindungen der Formel (I) neben geeigneten Formulierungshilfsmitteln enthalten.

Die erfindungsgemäßen Mittel enthalten die Wirkstoffe der Formel (I) im allgemeinen zu 1 bis 95 Gew.-%.

Zur Herstellung der erfindungsgemäßen Mittel gibt man den Wirkstoff und die weiteren Zusätze zusammen und bringt sie in eine geeignete Anwendungsform.

Die Erfindung betrifft auch Mittel, insbesondere insektizide und akarizide Mittel, die die Verbindungen der Formel (I) neben geeigneten Formulierungshilfsmitteln enthalten.

\_ -----

Die erfindungsgemäßen Mittel enthalten die Wirkstoffe der Formeln (I) im allgemeinen zu 1 bis 95 Gew.-%. Sie können auf verschiedene Art formuliert werden, je nachdem wie es durch die biologischen und/oder chemischphysikalischen Parameter vorgegeben ist. Als Formulierungsmöglichkeiten kommen daher beispielsweise in Frage:

Spritzpulver (WP), emulgierbare Konzentrate (EC), wäßrige Lösungen (SL), Emulsionen, versprühbare Lösungen, Dispersionen auf Öl- oder Wasserbasis (SC), Suspoemulsionen (SE), Stäubemittel (DP), Beizmittel, Granulate in Form von Mikro-, Sprüh-, Aufzugs- und Adsorptionsgranulaten, wasserdispergierbare Granulate (WG), ULV-Formulierungen, Mikrokapseln, Wachse oder Köder.

Diese einzelnen Formulierungstypen sind im Prinzip bekannt und beispielsweise beschrieben in: Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986; van Falkenberg, "Pesticides Formulations", Marcel Dekker N.Y., 2nd Ed. 1972-73; K. Martens, "Spray Drying Handbook", 3rd Ed. 1979, G. Goodwin Ltd. London.

Die notwendigen Formulierungshilfsmittel, d.h. Träger- und/oder oberflächenaktive Stoffe, wie Inertmaterialien, Tenside, Lösungsmittel und weitere Zusatzstoffe sind ebenfalls bekannt und beispielsweise beschrieben in: Watkins, "Handbook of Insecticide Dust Diluents and Garriers", 2nd Ed., Darland Books, Caldwell N.J.; H. v. Olphen, "Introduction to Clay Colloid Chemistry", 2nd Ed., J. Wiley & Sons, N.Y.; Marsden, "Solvents Guide", 2nd Ed., Interscience, N.Y. 1950; McCutcheon's, "Detergents and Emulsifiers Annual", MC Publ. Corp., Ridgewood N.J.; Sisley and Wood, "Encyclopedia of Surface Active Agents", Chem. Publ. Co. Inc., N.Y. 1964; Schönfeldt, "Grenzflächenaktive Äthylenoxidaddukte", Wiss. Verlagsgesell., Stuttgart 1967; Winnacker-Küchler, "Chemische Technologie", Band 7, C. Hauser Verlag München, 4. Aufl. 1986.

Auf der Basis dieser Formulierungen lassen sich auch Kombinationen mit anderen pestizid wirksamen Stoffen, Düngemitteln und/oder Wachstumsregulatoren

herstellen, z.B. in Form einer Fertigformulierung oder als Tankmix. Spritzpulver sind in Wasser gleichmäßig dispergierbare Präparate, die neben dem Wirkstoff außer einem Verdünnungs- oder Inertstoff noch Netzmittel, z.B. polyoxethylierte Alkylphenole, polyoxethylierte Fettalkohole, Alkyl- oder Alkylphenol-sulfonate und Dispergiermittel, z.B. ligninsulfonsaures Natrium, 2,2'-dinaphthylmethan-6,6'-disulfonsaures Natrium enthalten.

Emulgierbare Konzentrate werden durch Auflösen des Wirkstoffes in einem organischen Lösungsmittel, z.B. Butanol, Cyclohexanon, Dimethylformamid, Xylol oder auch höhersiedenden Aromaten oder Kohlenwasserstoffen unter Zusatz von einem oder mehreren Emulgatoren hergestellt. Als Emulgatoren können beispielsweise verwendet werden: Alkylarylsulfonsaure Calcium-Salze wie Cadodecylbenzol-sulfonat oder nichtionische Emulgatoren wie Fettsäurepolyglykolester, Alkylarylpolyglykolether, Fettalkoholpolyglykolether, Propylenoxid-Ethylenoxid-Kondensationsprodukte, Alkylpolyether, Sorbitanfettsäureester, Polyoxyethylensorbitan-Fettsäureester oder Polyoxethylensorbitester.

Stäubemittel erhält man durch Vermahlen des Wirkstoffes mit fein verteilten festen Stoffen, z.B. Talkum, natürlichen Tonen, wie Kaolin, Bentonit, Pyrophillit oder Diatomeenerde. Granulate können entweder durch Verdüsen des Wirkstoffes auf adsorptionsfähiges, granuliertes Inertmaterial hergestellt werden oder durch Aufbringen von Wirkstoffkonzentraten mittels Klebemitteln, z.B. Polyvinylalkohol, polyacrylsaurem Natrium oder auch Mineralölen, auf die Oberfläche von Trägerstoffen wie Sand, Kaolinite oder von granuliertem Inertmaterial. Auch können geeignete Wirkstoffe in der für die Herstellung von Düngemittelgranulaten üblichen Weise gewünschtenfalls in Mischung mit Düngemitteln – granuliert werden.

In Spritzpulvern beträgt die Wirkstoffkonzentration üblicherweise etwa 10 bis 90 Gew.-%, der Rest zu 100 Gew.-% besteht aus üblichen Formulierungsbestandteilen. Bei emulgierbaren Konzentraten kann die Wirkstoffkonzentration etwa 5 bis 80 Gew.-% betragen. Staubförmige Formulierungen enthalten meistens 5 bis 20 Gew.-

% an Wirkstoff, versprühbare Lösungen etwa 2 bis 20 Gew.-%. Bei Granulaten hängt der Wirkstoffgehalt zum Teil davon ab, ob die wirksame Verbindung flüssig oder fest vorliegt und welche Granulierhilfsmittel, Füllstoffe usw. verwendet werden.

Daneben enthalten die genannten Wirkstofformulierungen gegebenenfalls die jeweils üblichen Haft-, Netz-, Dispergier-, Emulgier-, Penetrations-, Lösungsmittel, Füll- oder Trägerstoffe.

Zur Anwendung werden die in handelsüblicher Form vorliegenden Konzentrate gegebenenfalls in üblicher Weise verdünnt, z.B. bei Spritzpulvern, emulgierbaren Konzentraten, Dispersionen und teilweise auch bei Mikrogranulaten mittels Wasser. Staubförmige und granulierte Zubereitungen sowie versprühbare Lösungen werden vor der Anwendung üblicherweise nicht mehr mit weiteren inerten Stoffen verdünnt.

Mit den äußeren Bedingungen wie Temperatur, Feuchtigkeit u.a. variiert die erforderliche Aufwandmenge. Sie kann innerhalb weiter Grenzen schwanken, z.B. zwischen 0,0005 und 10,0 kg/ha oder mehr Aktivsubstanz, vorzugsweise liegt sie jedoch zwischen 0,001 und 5 kg/ha Wirkstoff.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischungen mit anderen Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Akariziden, Nematiziden, Fungiziden, wachstumsregulierenden Stoffen oder Herbiziden vorliegen.

Zu den Schädlingsbekämpfungsmitteln zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, Formamidine, Zinnverbindungen und durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe.

Bevorzugte Mischungspartner sind:

## aus der Gruppe der Phosphorverbindungen

Acephate, Azamethiphos, Azinphos-ethyl, Azinphos-methyl, Bromophos, Bromophos-ethyl, Cadusafos (F-67825), Chlorethoxyphos, Chlorfenvinphos, Chlormephos, Chlorpyrifos, Chlorpyrifos-methyl, Demeton, Demeton-S-methyl, Demeton-S-methyl sulfon, Dialifos, Diazinon, Dichlorvos, Dicrotophos, Dimethoate, Disulfoton, EPN, Ethion, Ethoprophos, Etrimfos, Famphur, Fenamiphos, Fenitriothion, Fensulfothion, Fenthion, Fonofos, Formothion, Fosthiazate (ASC-66824) Heptenophos, Isazophos, Isothioate, Isoxathion, Malathion, Methacrifos, Methamidophos, Methidathion, Salithion, Mevinphos, Monocrotophos, Naled, Omethoate, Oxydemeton-methyl, Parathion, Parathion-methyl, Phenthoate, Phorate, Phosalone, Phosfolan, Phosphocarb (BAS-301), Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimiphos, Pirimiphos-ethyl, Pirimiphos-methyl, Profenofos, Propaphos, Proetamphos, Prothiofos, Pyraclofos, Pyridapenthion, Quinalphos, Sulprofos, Temephos, Terbufos, Tebupirimfos, Tetrachlorvinphos, Thiometon, Triazophos, Trichlorphon, Vamidothion;

## 2. aus der Gruppe der Carbamate

Alanycarb (OK-135), Aldicarb, 2-sec.-Butylphenylmethylcarbamate (BPMC), Carbaryl, Carbofuran, Carbosulfan, Cloethocarb, Benfuracarb, Ethiofencarb, Furathiocarb, HCN-801, Isoprocarb, Methomyl, 5-Methyl-m-cumenylbutyryl(methyl)carbamate, Oxamyl, Pirimicarb, Propoxur, Thiodicarb, Thiofanox, 1-Methylthio(ethylideneamino)-N-methyl-N-(morpholinothio)carbamate (UC 51717), Triazamate;

# 3. aus der Gruppe der Carbonsäureester

Acrinathrin, Allethrin, Alphametrin, 5-Benzyl-3-furylmethyl-(E)-(1R)-cis-2,2-dimethyl-3-(2-oxothiolan-3-ylidenemethyl)cyclopropanecarboxylate, Beta-Cyfluthrin, Beta-Cypermethrin, Bioallethrin, Bioallethrin((S)-cyclopentylisomer), Bioresmethrin, Bifenthrin, (RS)-1-Cyano-1-(6-phenoxy-2-pyridyl)methyl-(1RS)-trans-3-(4-tert.butylphenyl)-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylate (NCI 85193), Cycloprothrin, Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cythithrin, Cypermethrin, Cyphenothrin, Deltamethrin,

Empenthrin, Esfenvalerate, Fenfluthrin, Fenpropathrin, Fenvalerate, Flucythrinate, Flumethrin, Fluvalinate (D-Isomer), Imiprothrin (S-41311), Lambda-Cyhalothrin, Permethrin, Phenothrin ((R)-Isomer), Prallethrin, Pyrethrine (natürliche Produkte), Resmethrin, Tefluthrin, Tetramethrin, Theta-Cypermethrin (TD-2344), Tralomethrin, Transfluthrin, Zeta-Cypermethrin (F-56701);

- aus der Gruppe der Amidine
   Amitraz, Chlordimeform;
- aus der Gruppe der Zinnverbindungen
   Cyhexatin, Fenbutatinoxide;

## 6. Sonstige

Abamectin, ABG-9008, Acetamiprid, Anagrapha falcitera, AKD-1022, AKD-3059, ANS-118, Bacillus thuringiensis, Beauveria bassianea, Bensultap, Bifenazate (D-2341), Binapacryl, BJL-932, Bromopropylate, BTG-504, BTG-505, Buprofezin, Camphechlor, Cartap, Chlorobenzilate, Chlorfenapyr, Chlorfluazuron, 2-(4-Chlorphenyl)-4,5-diphenylthiophen (UBI-T 930), Chlorfentezine, Chromafenozide (ANS-118), CG-216, CG-217, CG-234, A-184699, Cyclopropancarbonsäure-(2naphthylmethyl)ester (Ro12-0470), Cyromazin, Diacloden (Thiamethoxam), Diafenthiuron, N-(3,5-Dichlor-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluor-1-propyloxy) phenyl)carbamoyl)-2-chlorbenzcarboximidsäureethylester, DDT, Dicofol, Diflubenzuron, N-(2,3-Dihydro-3-methyl-1,3-thiazol-2-ylidene)-2,4-xylidine, Dinobuton, Dinocap, Diofenolan, DPX-062, Emamectin-Benzoate (MK-244), Endosulfan, Ethiprole (Sulfethiprole), Ethofenprox, Etoxazole (YI-5301), Fenazaquin, Fenoxycarb, Fipronil, Fluazuron, Flumite (Flufenzine, SZI-121), 2-Fluoro-5-(4-(4ethoxyphenyl)-4-methyl-1-pentyl)diphenylether (MTI 800), Granulose- und Kernpolyederviren, Fenpyroximate, Fenthiocarb, Flubenzimine, Flucycloxuron, Flufenoxuron, Flufenprox (ICI-A5683), Fluproxyfen, Gamma-HCH, Halofenozide (RH-0345), Halofenprox (MTI-732), Hexaflumuron (DE\_473), Hexythiazox, HOI-9004, Hydramethylnon (AC 217300), Lufenuron, Imidacloprid, Indoxacarb (DPX-

35

MP062), Kanemite (AKD-2023), M-020, MTI-446, Ivermectin, M-020, Methoxyfenozide (Intrepid, RH-2485), Milbemectin, NC-196, Neemgard, Nitenpyram (TI-304), 2-Nitromethyl-4,5-dihydro-6H-thiazin (DS 52618), 2-Nitromethyl-3,4-dihydrothiazol (SD 35651), 2-Nitromethylene-1,2-thiazinan-3-ylcarbamaldehyde (WL 108477), Pyriproxyfen (S-71639), NC-196, NC-1111, NNI-9768, Novaluron (MCW-275), OK-9701, OK-9601, OK-9602, Propargite, Pymethrozine, Pyridaben, Pyrimidifen (SU-8801), RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SB7242, SI-8601, Silafluofen, Silomadine (CG-177), Spinosad, SU-9118, Tebufenozide, Tebufenpyrad (MK-239), Teflubenzuron, Tetradifon, Tetrasul, Thiacloprid, Thiocyclam, TI-435, Tolfenpyrad (OMI-88), Triazamate (RH-7988), Triflumuron, Verbutin, Vertalec (Mykotal), YI-5301,

Die oben genannten Kombinationspartner stellen bekannte Wirkstoffe dar, die zum großen Teil in Ch.R Worthing, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 11. Auflage, British Crop Protection Council Farnham, 1997 beschrieben sind.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann von 0,00000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,00001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepaßten üblichen Weise.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von Endound Ektoparasiten auf dem veterinärmedizinischen Gebiet bzw. auf dem Gebiet der Tierhaltung. Die Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geschieht hier in bekannter Weise wie durch orale Anwendung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Granulaten, durch dermale Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens (Dippen), Sprühens (Sprayen), Aufgießen (pour-on and spot-on) und des Einpuderns sowie durch parenterale Anwendung in Form beispielsweise der Injektion. Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) können demgemäß auch besonders vorteilhaft in der Viehhaltung (z.B. Rinder, Schafe, Schweine und Geflügel wie Hühner, Gänse usw.) eingesetzt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform der Erfindung werden den Tieren die Verbindungen, gegebenenfalls in geeigneten Formulierungen und gegebenenfalls mit dem Trinkwasser oder Futter oral verabreicht. Da eine Ausscheidung im Kot in wirksamer Weise erfolgt, läßt sich auf diese Weise sehr einfach die Entwicklung von Insekten im Kot der Tiere verhindern. Die jeweils geeigneten Dosierungen und Formulierungen sind insbesondere von der Art und dem Entwicklungsstadium der Nutztiere und auch vom Befallsdruck abhängig und lassen sich nach den üblichen Methoden leicht ermitteln und festlegen. Die Verbindungen können bei Rindern z.B. in Dosierungen von 0,01 bis 1 mg/kg Körpergewicht eingesetzt werden.

Neben den bisher genannten Applikationsverfahren zeigen die erfindungsgemässen Wirkstoffe der Formel (I) eine hervorragende systemische Wirkung. Die Wirkstoffe können daher auch über Pflanzenteile, unterirdische wie oberirdische (Wurzel, Stengel, Blatt), in die Pflanzen eingebracht werden, wenn die Wirkstoffe in flüssiger oder fester Form in die direkte Umgebung der Pflanze appliziert werden (z.B. Granulate in der Erdapplikation, Applikation in gefluteten Reisfeldern).

Daneben sind die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in besonderer Weise zu Behandlung von vegetativen und generativen Vermehrungsmaterial einsetzbar, wie z.B. von Saatgut von beispielsweise Getreide, Gemüse, Baumwolle, Reis, Zuckerrübe und anderen Kultur- und Zierpflanzen, von Zwiebeln, Stecklingen und Knollen weiterer vegetativ vermehrter Kultur- und Zierpflanzen. Die Behandlung hierfür kann vor der Saat bzw. dem Pflanzvorgang erfolgen (z.B. durch spezielle Techniken des Seedcoatings, durch Beizung in flüssiger oder fester Form oder Seedboxtreatment), während des Saatvorgangs bzw. des Pflanzens oder nach dem Saat- bzw. Pflanzvorgang durch spezielle Applikationstechniken (z.B. Saatreihenbehandlung). Die angewandte Wirkstoffmenge kann entsprechend der

37

Anwendung in einem größerem Bereich schwanken. Im allgemeinen liegen die Aufwandmengen zwischen 1 g und 10 kg Wirkstoff pro Hektar Bodenfläche.

Die Verbindungen der Formel (I) können auch zur Bekämpfung von Schadpflanzen in Kulturen von bekannten oder noch zu entwickelnden gentechnisch veränderten Pflanzen eingesetzt werden. Die transgenen Pflanzen zeichnen sich in der Regel durch besondere vorteilhafte Eigenschaften aus, beispielsweise durch Resistenzen gegenüber bestimmten Pflanzenschutzmitteln, Resistenzen gegenüber Pflanzenkrankheiten oder Erregern von Pflanzenkrankheiten, wie bestimmten Insekten oder Mikroorganismen, wie Pilzen, Bakterien oder Viren. Andere besondere Eigenschaften betreffen z.B. das Erntegut hinsichtlich Menge, Qualität, Lagerfähigkeit, Zusammensetzung und spezieller Inhaltsstoffe. So sind transgene Pflanzen mit erhöhtem Stärkegehalt oder veränderter Qualität der Stärke oder solche mit anderer Fettsäurezusammensetzung des Ernteguts bekannt.

Bevorzugt ist die Anwendung in wirtschaftlich bedeutenden transgenen Kulturen von Nutz- und Zierpflanzen, z.B. von Getreide, wie Weizen, Gerste, Roggen, Hafer, Hirse, Reis, Maniok und Mais, oder auch Kulturen von Zuckerrübe, Baumwolle, Soja, Raps, Kartoffel, Tomate, Erbse und anderen Gemüsesorten.

Bei der Anwendung in transgenen Kulturen, insbesondere mit Insektenresistenzen treten neben den in anderen Kulturen zu beobachtenden Wirkungen gegenüber Schadorganismen oftmals Wirkungen auf, die für die Applikation in der jeweiligen transgenen Kultur spezifisch sind, beispielsweise ein verändertes oder speziell erweitertes Schädlingsspektrum, das bekämpft werden kann oder veränderte Aufwandmengen, die für die Applikation eingesetzt werden können.

Gegenstand der Erfindung ist deshalb auch die Verwendung von Verbindungen der Formel (I) zur Bekämpfung von Schadorganismen in transgenen Kulturpflanzen.

Die Anwendung der erfindungsgemäßen Verbindungen beinhaltet neben direkter Applikation auf die Schädlinge jede andere Applikation, bei der Verbindungen der Formel (I) auf die Schädlinge wirken. Solche indirekten Applikationen können beispielsweise in der Anwendung von Verbindungen liegen, die, beispielsweise im Boden, der Pflanze oder dem Schädling, zu Verbindungen der Formel (I) zerfallen oder abgebaut werden.

Auf den Inhalt der deutschen Patentanmeldung 198 581 93.9, deren Priorität die vorliegende Anmeldung beansprucht, sowie auf den Inhalt der beiliegenden Zusammenfassung wird hiermit ausdrücklich Bezug genommen; sie gelten durch Zitat als Bestandteil dieser Beschreibung.

Nachfolgende Beispiele dienen zur Erläuterung der Erfindung.

## A. Chemische Beispiele

#### Beispiel 1

Eine Lösung von 4-Trifluormethylnicotinsäure (2,2 g) in 40 ml THF wurde bei Raumtemperatur mit 1,1-Carbonyldiimidazol (1,9 g) versetzt und 30 min auf 40°C erhitzt. Anschließend gab man Furfurylsulfonylacetamidoxim (2,5 g) zu und ließ bei 40°C weitere 5 h rühren. Dann wurde das Reaktionsgemisch im Vakuum eingeengt und auf Eiswasser gegossen. Der entstandene Niederschlag wurde abgesaugt und abschließend im Trockenschrank getrocknet. Man erhielt 4-Trifluormethylnicotinsäure-(furfurylsulfonylacetamidoxim)-ester in Form eines farblosen Feststoffs (Schmelzpunkt 171°C).

<sup>1</sup>H-NMR (DMSO-d<sup>6</sup>, 300 MHz): 4.09 (s, 2H), 4.86 (s, 2H), 6.55 (m, 1H), 6.63 (m, 1H), 7.08 (s, 2H), 7.75 (m, 1H), 7.94 (d, J=5Hz, 1H), 9.07 (d, J=5Hz, 1H), 9.30 (s, 1H).

### Beispiel 2

Den zuvor beschriebenen Amidoximester (4,0 g) versetzte man mit 80 ml Toluol und 60 ml Xylol sowie Amberlyst 15 (1,0 g). Das Reaktionsgemisch wurde 6 h auf 125°C erhitzt. Anschließend wurde abgesaugt und das Filtrat im Vakuum eingeengt und durch Chromatographie (Kieselgel, Ethylacetat/Petrolether, 4:1) gereinigt. Durch abschließendes Ausrühren mit n-Heptan erhielt man [5-(4'-Trifluormethylpyridin-3'yl)-[1,2,4]-oxdiazol-3-methyl]-furfuryl-sulfon als hellgelben Feststoff (Schmelzpunkt 99°C).

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz): 4.53 (s, 2H), 4.62 (s, 2H), 6.44 (m, 1H), 6.69 (m 1H), 7.54 (m, 1H), 7.82 (d, J=5Hz, 1H), 9.08 (d, J=5Hz, 1H), 9.40 (s, 1H).

## Beispiel 3

Ein Gemisch von 3-Chlormethyl-5-(4-trifluormethyl-3-pyridyl)-1,2,4-oxadiazol (1,0 g), Natriumsulfit (0,9 g), Wasser (18 ml) und Methanol (18 ml) wurde 6 Stunden lang bei 50° gerührt. Anschließend wurde das Reaktionsgemisch eingeengt der Rückstand in Methanol aufgenommen und filtriert. Danach wurde die Methanol-Lösung eingeengt und den Rückstand mit Dieethylether ausgerührt. Auf diese Weise wurde

als schwach gelblicher Feststoff erhalten (Fp = 214°C).

<sup>1</sup>H-NMR (DMSO-d<sup>6</sup>, 300 MHz): 4.02 (s, 2H), 8.09 (d, J=5H, 1H), 9.15 (d, J=5Hz, 1H), 9.33 (s, 1H).

Das oben beschriebene Natriumsulfonat (0,95 g) wurde in Phosphoroxychlorid 30 ml) suspendiert und 5 Stunden lang auf Rückflußtemperatur erhitzt. Anschließend wurde das überschüssige Phosphoroxychlorid abdestilliert und das zurückbleibende Sulfonylchlorid in Dichlormethan (10 ml) aufgenommen. Diese Suspension wurde mit Ethylmethylamin (150 ml) versetzt und noch eine Stunde bei Raumtemperatur nachgerührt.

Anschließend wurde mit Wasser, 5 %iger wäßriger Kaliumhydrogensulfatlösung und mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung gewaschen. Das nach Trocknen (MgSO<sub>4</sub>) und Einengen der Dichlormethanphase erhaltene Rohprodukt wurde chromatographisch gereinigt. Auf diese Weise wurde das gewünschte Sulfonamid als farbloses Öl erhalten.

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz): 1.23 (6, J=7Hz, 3H), 2.92 (s, 3H), 3.25 (Q, J=7Hz), 2H), 4.54 (s, 2H), 7.90 (d, J=5Hz, 1H), 9.06 (d, J=5Hz, 1H), 9.35 (s, 1H).

In analoger Weise werden die in Tabelle 1 aufgeführten Sulfonamide hergestellt.

### Beispiel 4

3-[(2-Hydroxyethyl)thiomethyl]-5-(4-trifluormethyl-3-pyridyl)-1,2,4-oxadiazol

Zu einer Lösung von 3-Chlormethyl-5-(4-trifluormethyl-3-pyridyl)-1,2,4-oxadiazol (0,5 g), 2-Mercaptoethanol (0,13 g) in Methanol (5 ml) wurde Natriummethanolatlösung (0,31 ml, 30 % in Methanol) gegeben und 5 Stunden bei Raumtemperatur gerührt.

PCT/EP99/09684

Anschließend wurde Wasser zugesetzt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wurde mit Wasser gewaschen, getrocknet (MgSO<sub>4</sub>), filtriert und eingeengt. Die chromatographische Reinigung erfolgte an Kieselgel mit Heptan/Essigsäureethylester. Das Rohprodukt ergab die gewünschte Verbindung als schwach braunes Öl.

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz): 2.88 (t, J=7Hz, 2H), 3.04 (b, s, 1H), 3.82 (t, J=7Hz, 2H), 3.94 (s, 2H), 7.80 (d, J=5Hz, 1H), 9.04 (d, J=5Hz, 1H), 9.35 (s, 1H).

Beispiel 5

WO 00/35913

3-Ethoxymethy!-5-(4-trifluormethyl-3-pyridyl)-1,2,4-oxadiazol

3-lodmethyl-5-(4-trifluormethyl-3-pyridyl)-1,2,4-oxadiazol (0,5 g) wurde in einer frisch hergestellten Natriumethanolatlösung (30 mg Natrium in 7 ml Ethanol) gelöst und 6 Stunden lang bei Raumtemperatur gerührt.

Anschließend wurde das Reaktionsgemisch eingeengt, in Essigsäureethylester aufgenommen, mit Wasser gewaschen, getrocknet (MgSO<sub>4</sub>), filtriert und eingeengt.

Die chromatographische Reinigung des Rohprodukts ergab den gewünschten Ether als gelbliches Öl.

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz): 1.31 (t, J=7Hz, 3H), 3.72 (t, J=7Hz, 2H), 4.76 (s, 2H), 7.70 (d, J=5Hz, 1H), 9.03 (d, J=5Hz, 1H), 9.33 (s, 1H).

In analoger Weise werden die in Tabelle 1 aufgeführten Ether hergestellt.

## Beispiel 6

Ethyl-[(4'-(trifluormethyl)pyridin-3'-yl)-5-[1,2,4]-oxadiazol-3-methyl]-carbonat

3-Hydroxymethyl-5-(4'-(trifluormethyl)-pyridin-3'-yl)-[1,2,4]-oxadiazol (1,0 g) wurde in Acetonitril (10 ml) vorgelegt und mit Triethylamin (0,5 g) versetzt. Nach Zugabe von Chlorameisensäureethylester (0,5 g) wurde 6 h bei Raumtemperatur gerührt. Das Reaktionsgemisch wurde sodann mit Ethylacetat (5 ml) versetzt, mit 2N Natriumcarbonatlösung gewaschen und über MgSO<sub>4</sub> getrocknet. Das nach Abfiltrieren des Trockenmittels und Einengen im Vakuum erhaltene Rohprodukt wurde säulenchromatographisch (Kieselgel, n-Heptan/Ethylacetat, 1:1) gereinigt. Man erhielt das angestrebte Produkt als Öl.

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, 300 MHz): 1.38 (t, J=7Hz, 3H), 4.31 (q, J=7Hz, 2H), 5.43 (s, 2H), 7.80 (d, J=5Hz, 1H), 9.04 (d, J=5Hz, 1H), 9.37 (s, 1H).

Tabelle 1:

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
1	0	n-Pr	1	
2	0	i-Pr		
3	0	n-Bu	1	
4	0	Ìi-Bu	1	Öl
5	0	Allyi	1	
6	0	CH <sub>2</sub> C≡CH	- [	
7	0	CH=CH₂	1	
8	0	CH₂CH₂F	1	
9	0	CF <sub>3</sub>	-	
10	0	CH₂CF₃	1	l l
11	0	CH₂CN		
12	0	Cyclopropyl	1	
13	0	Cyclopropylmethyl	-	1
14	0	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		<u></u>

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
15	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
16	0	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		l
17	0	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
18	0	2-Furanyl		
19	0	2-Pyrimidinyl		
20	0	2-Oxazolyl		ł
21	0	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		1
22	0	Tetrazolyl		
23	S	H		
24	S	Me		
25	S S	Et		
26	S	n-Pr		
27	S	i-Pr		
28	S	n-Bu		
29	S	i-Bu		
30	S	Allyl		
31	S	CH₂C≡CH		
32	S	CH=CH <sub>2</sub>		
33	s .	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		1
34	S .	CF <sub>3</sub>		
35	S	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		
36	S	CH <sub>2</sub> CN	1	
37	S	Cyclopropyl		
38	S	Cyclopropylmethyl		
39	S	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	1	
40	S	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	1	
41	S	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
42	S	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	1	
43	S	2-Furanyl		]
44	s	2-Pyrimidinyl		}
45	s	2-Oxazolyl		
46	S		1	1
47	S	5-[1,2,4]-oxdiazolyl Tetrazolyl		
	l.,	1	-	ļ
48	S(O)	Me	1	
49	S(O)	Et D	İ	<u> </u>
50	S(O)	n-Pr		
51	S(O)	i-Pr	1	
52	S(O)	n-Bu		
53	S(O)	i-Bu	1	
54	S(O)	Allyl	1	
55	S(O)	CH₂C≡CH		
56	S(O)	CH=CH <sub>2</sub>	1	
57	S(O)	CH₂CH₂F	l	1
58	S(O)	CF <sub>3</sub>		1
59	S(O)	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		
60	S(O)	CH <sub>2</sub> CN		
61	S(O)	Cyclopropyi	1	
62	S(O)	Cyclopropylmethyl		
63	S(O)	CH₂CO₂Me		1

MICONOID 440 M3E01341 1 -

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
64	S(O)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
65	S(O)	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
66	S(O)	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
67	S(O)	2-Furanyl		1
68		2-Pyrimidinyl		1
1	S(O)			
69	S(O)	2-Oxazolyl	]	
70	S(O)	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
71	S(O)	Tetrazolyl		
72	S(O) <sub>2</sub>	Me		
73	S(O) <sub>2</sub>	Et		
74	S(O) <sub>2</sub>	n-Pr		
75	S(O) <sub>2</sub>	i-Pr		
76	S(O) <sub>2</sub>	n-Bu		
77	S(O) <sub>2</sub>	i-Bu		
78	S(O) <sub>2</sub>	Aliyi		
79	S(O) <sub>2</sub>	CH₂C≡CH		
80	S(O) <sub>2</sub>	CH=CH <sub>2</sub>		
81	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		
82	S(O) <sub>2</sub>			
83		CF₃		1
	S(O) <sub>2</sub>	CH₂CF₃		
84	S(O)₂	CH₂CN		
85	S(O) <sub>2</sub>	Cyclopropyl		1
86	S(O) <sub>2</sub>	Cyclopropylmethyl		ļ
87	S(O) <sub>2</sub>	CH₂CO₂Me		1
88	S(O) <sub>2</sub>	CH₂CH₂NMe₂		
89	S(O) <sub>2</sub>	CH₂-(N-morpholinyl)	1	1
90	S(O) <sub>2</sub>	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
91	S(O) <sub>2</sub>	2-Furanyl		İ
92	S(O) <sub>2</sub>	2-Pyrimidinyl	1	
93	S(O) <sub>2</sub>	2-Oxazolyl		
94	S(O) <sub>2</sub>	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
94a	S(O) <sub>2</sub>	Tetrazolyl		
95	OC(O)	Н		
96	00(0)	Me		
97	OC(O)	Et	1	[
98	00(0)	n-Pr		[
99		i-Pr		1
	00(0)		i	
100	OC(O)	n-Bu		1
101	OC(O)	i-Bu	1	[
102	OC(O)	Allyi	1	
103	OC(O)	CH <sub>2</sub> C≡CH	1	Į ·
104	OC(O)	CH=CH₂	ļ	
105	OC(O)	CH₂CH₂F		
106	OC(O)	CF <sub>3</sub>		
107	loc(o)	CH₂CF₃	1	
108	oc(o)	CH,CN	1	
109	00(0)	Cyclopropyl		
110	00(0)	Cyclopropylmethyl	1	ì
111	00(0)	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	1	1

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
112	OC(O)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
113	OC(O)	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Í	
114	OC(O)	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		]
115	OC(O)	2-Furanyl	1	]
116	OC(O)	2-Pyrimidinyl		
117	oc(o)	2-Oxazolyl	]	
118	oc(o)	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
119	oc(o)	Tetrazolyl		
120	00(0)0	Me		
121	00(0)0	Et		
122	00(0)0	n-Pr		
123	00(0)0	i-Pr		
124	00(0)0	n-Bu		
125	00(0)0	i-Bu		
126	00(0)0	Aliyi		l
127	00(0)0	CH,C≡CH		İ
128	00(0)0	CH <sub>2</sub> C=CH CH=CH <sub>2</sub>		
129	00(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> F		
130	00(0)0			
131	00(0)0	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		
132	00(0)0	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CN		
133	00(0)0	-		
134	00(0)0	Cyclopropyl		
135	00(0)0	Cyclopropylmethyl		İ
136	00(0)0	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		
137	00(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
138	00(0)0	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
139	00(0)0	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
140	00(0)0	2-Furanyl		
141	00(0)0	2-Pyrimidinyl		
142	00(0)0	2-Oxazolyl		
143	00(0)0	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
144		Tetrazolyl		
	00(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	ļ	
145	OC(O)NR'	H	Н	
146 147	OC(O)NR'	Me	H	
	OC(O)NR'	Et	H	
148	OC(O)NR'	n-Pr	Н	
149	OC(O)NR'	i-Pr	H	
150	OC(O)NR'	n-Bu	Н	
151	OC(O)NR'	i-Bu	H	]
152	OC(O)NR'	Allyl	H	
153	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> C≡CH	H	
154	OC(O)NR'	CH=CH₂	H	
155	OC(O)NR'	CH₂CH₂F	H	
156	OC(O)NR'	CF <sub>3</sub>	H	
157	OC(O)NR"	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
158	OC(O)NR'	CH₂CN	Н	
159	OC(O)NR'	Cyclopropyl	H	] !
160	OC(O)NR'	Cyclopropylmethyl	Н	<u></u>

161	Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
163 OC(O)NR' CH₂-(N-morpholinyl) 164 OC(O)NR' 2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl 165 OC(O)NR' 2-Furanyl 166 OC(O)NR' 2-Pyrimidinyl H 167 OC(O)NR' 2-Pyrimidinyl H 168 OC(O)NR' 2-Oxazolyl H 169 OC(O)NR' 5-{1,2,4}-oxdiazolyl H 169 OC(O)NR' Tetrazolyl H 170 OC(O)NR' Me Me 171 OC(O)NR' Me Me 172 OC(O)NR' I-Pr 174 OC(O)NR' I-Pr 175 OC(O)NR' I-Pr 176 OC(O)NR' I-Bu Me 177 OC(O)NR' I-Bu Me 177 OC(O)NR' CH₂C≡CH Me 179 OC(O)NR' CH₂C□CH Me 180 OC(O)NR' CH₂C□CH Me 181 OC(O)NR' CH₂C□CH Me 182 OC(O)NR' CH₂C□CH Me 183 OC(O)NR' CH₂C□CH Me 184 OC(O)NR' CH₂C□C Me 185 OC(O)NR' CH₂C□C Me 186 OC(O)NR' CH₂C□C Me 187 OC(O)NR' CH₂C□C Me 188 OC(O)NR' CH₂C□C Me 189 OC(O)NR' CH₂C□C Me 180 OC(O)NR' CH₂C□C Me 181 OC(O)NR' CH₂C□C Me 182 OC(O)NR' CH₂C□C Me 183 OC(O)NR' CH₂C□C Me 184 OC(O)NR' CH₂C□C Me 185 OC(O)NR' CH₂C□C Me 186 OC(O)NR' CH₂C□C Me 187 OC(O)NR' CH₂C□C Me 188 OC(O)NR' CH₂C□C Me 189 OC(O)NR' CH₂C□C Me 180 OC(O)NR' CH₂C□C Me 181 OC(O)NR' CH₂C□C Me 182 OC(O)NR' CH₂C□C Me 184 OC(O)NR' CH₂C□C Me 185 OC(O)NR' CH₂C□C Me 186 OC(O)NR' CH₂C□C Me 187 OC(O)NR' CH₂C□C Me 188 OC(O)NR' CH₂C□C Me 189 OC(O)NR' CH₂C□C Me 190 OC(O)NR' CH₂C□C Me 191 OC(O)NR' CH₂C□C Me 192 OC(O)NR' CH₂C□C Me 193 OC(O)NR' CH₂C□C Me 194 OC(O)NR' D-Pr 195 OC(O)NR' Me 196 OC(O)NR' Me 197 OC(O)NR' Me 198 OC(O)NR' Me 199 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 191 OC(O)NR' Me 191 OC(O)NR' Me 192 OC(O)NR' Me 193 OC(O)NR' Me 194 OC(O)NR' Me 195 OC(O)NR' Me 196 OC(O)NR' Me 197 OC(O)NR' Me 198 OC(O)NR' Me 199 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 191 OC(O)NR' Me 192 OC(O)NR' Me 193 OC(O)NR' Me 194 OC(O)NR' Me 195 OC(O)NR' Me 196 OC(O)NR' Me 197 OC(O)NR' Me 198 OC(O)NR' Me 199 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 191 OC(O)NR' Me 191 OC(O)NR' Me 192 OC(O)NR' Me 193 OC(O)NR' Me 194 OC(O)NR' Me 195 OC(O)NR' Me 196 OC(O)NR' Me 197 OC(O)NR' Me 198 OC(O)NR' Me 199 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 190 OC(O)NR' Me 190 OC(	161	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Н	
163 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl) H H H H H H H H H H H H H H H H H H H	162	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Н	
164	163			н	
165	164	, , ,		н	
166					
167					
168					
169	1				
170 OC(O)NR' Me Me Me 171 OC(O)NR' Et Me Me 172 OC(O)NR' Et Me 173 OC(O)NR' I-Pr Me 174 OC(O)NR' I-Pr Me 175 OC(O)NR' I-Pr Me 176 OC(O)NR' I-Bu Me 177 OC(O)NR' I-Bu Me 177 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> C≡CH Me 179 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> C=CH Me 180 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Me 181 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Me 182 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CN Me 183 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CN Me 184 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CN Me 185 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CN Me 186 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CN Me 187 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CN Me 188 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CN-CN Me 189 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> Me 180 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me Me 181 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me Me 182 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me Me 183 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me Me 184 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me Me 185 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me Me 187 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me Me 188 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me Me 189 OC(O)NR' C-F <sub>1</sub> CO <sub>2</sub> Me Me 190 OC(O)NR' 2-Pyrimidinyl Me 191 OC(O)NR' 2-Pyrimidinyl Me 192 OC(O)NR' 2-Oxazolyl Me 193 OC(O)NR' Tetrazolyl Me 194 OC(O)NR' H Et Et 196 OC(O)NR' H Et 197 OC(O)NR' I-Pr 198 OC(O)NR' I-Pr 199 OC(O)NR' I-Pr 199 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 191 OC(O)NR' I-Pr 192 OC(O)NR' I-Pr 193 OC(O)NR' I-Pr 194 OC(O)NR' I-Pr 195 OC(O)NR' I-Pr 196 OC(O)NR' I-Pr 197 OC(O)NR' I-Pr 198 OC(O)NR' I-Pr 199 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 191 OC(O)NR' I-Pr 192 OC(O)NR' I-Pr 193 OC(O)NR' I-Pr 194 OC(O)NR' I-Pr 195 OC(O)NR' I-Pr 196 OC(O)NR' I-Pr 197 OC(O)NR' I-Pr 198 OC(O)NR' I-Pr 199 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 191 OC(O)NR' I-Pr 192 OC(O)NR' I-Pr 193 OC(O)NR' I-Pr 194 OC(O)NR' I-Pr 195 OC(O)NR' I-Pr 196 OC(O)NR' I-Pr 197 OC(O)NR' I-Pr 198 OC(O)NR' I-Pr 199 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 191 OC(O)NR' I-Pr 191 OC(O)NR' I-Pr 192 OC(O)NR' I-Pr 193 OC(O)NR' I-Pr 194 OC(O)NR' I-Pr 195 OC(O)NR' I-Pr 196 OC(O)NR' I-Pr 197 OC(O)NR' I-Pr 198 OC(O)NR' I-Pr 199 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-Pr 190 OC(O)NR' I-PR 190 OC(O)NR' I-PR 190 OC(O)NR' I-PR 190 OC(O)NR' I-PR 190 OC(O)NR' I-PR	1				1
171					
172	1				
173 OC(O)NR' n-Pr		, ,			
174 OC(O)NR' i-Pr Me Me 175 OC(O)NR' n-Bu Me 176 OC(O)NR' i-Bu Me 177 OC(O)NR' i-Bu Me 177 OC(O)NR' Allyl Me 178 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> C≡CH Me 179 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F Me 180 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F Me 181 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Me 182 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Me 183 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CR <sub>3</sub> Me 184 OC(O)NR' Cyclopropyl Me 185 OC(O)NR' Cyclopropylmethyl Me 186 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me Me 187 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me Me 188 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me Me 189 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> Me 189 OC(O)NR' 2-Furanyl Me 190 OC(O)NR' 2-Pyrimidinyl Me 191 OC(O)NR' 5-[1,2,4]-oxdiazolyl Me 192 OC(O)NR' Tetrazolyl Me 194 OC(O)NR' H Et Et 196 OC(O)NR' H Et Et 197 OC(O)NR' i-Pr Et 199 OC(O)NR' i-Pr Et 200 OC(O)NR' i-Bu Et 201 OC(O)NR' i-Bu Et 201 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> C=CH Et 203 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> C=CH Et 204 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> C=CH Et 205 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 208 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 208 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 208 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 208 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 208 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CR	t	, , ,			
175         OC(O)NR'         n-Bu         Me           176         OC(O)NR'         i-Bu         Me           177         OC(O)NR'         Allyl         Me           178         OC(O)NR'         CH <sub>2</sub> C=CH         Me           179         OC(O)NR'         CH=CH <sub>2</sub> Me           180         OC(O)NR'         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F         Me           181         OC(O)NR'         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F         Me           182         OC(O)NR'         CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Me           183         OC(O)NR'         CH <sub>2</sub> CN         Me           184         OC(O)NR'         Cyclopropylmethyl         Me           185         OC(O)NR'         Cyclopropylmethyl         Me           186         OC(O)NR'         Cyclopropylmethyl         Me           187         OC(O)NR'         CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me         Me           188         OC(O)NR'         CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> Me           189         OC(O)NR'         2-Purimidinyl         Me           190         OC(O)NR'         2-Purimidinyl         Me           191         OC(O)NR'         2-Oxazolyl         Me           195         OC(O)NR'         H         Et <td>1</td> <td>, ,</td> <td></td> <td></td> <td></td>	1	, ,			
176					Ę
177 OC(O)NR' Allyl Me 178 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> C≡CH Me 179 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F 180 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F 181 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> F 182 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Me 183 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CN Me 184 OC(O)NR' Cyclopropyl Me 185 OC(O)NR' Cyclopropylmethyl Me 186 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me Me 187 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CN <sub>2</sub> Me 188 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CN <sub>2</sub> Me 189 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CN-morpholinyl) Me 190 OC(O)NR' 2-Furanyl Me 191 OC(O)NR' 2-Pyrimidinyl Me 192 OC(O)NR' 2-Oxazolyl Me 193 OC(O)NR' Tetrazolyl Me 194 OC(O)NR' H 195 OC(O)NR' H 196 OC(O)NR' H 197 OC(O)NR' Et 198 OC(O)NR' Et 199 OC(O)NR' I-Pr 199 OC(O)NR' I-Pr 200 OC(O)NR' I-Bu 201 OC(O)NR' I-Bu 202 OC(O)NR' Allyl Et 203 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> C≡CH Et 204 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et	i				
178	1				
179       OC(O)NR'       CH=CH₂       Me         180       OC(O)NR'       CH₂CH₂F       Me         181       OC(O)NR'       CH₂CF₃       Me         182       OC(O)NR'       CH₂CR₃       Me         183       OC(O)NR'       CH₂CR₃       Me         184       OC(O)NR'       Cyclopropy!       Me         185       OC(O)NR'       Cyclopropylmethy!       Me         186       OC(O)NR'       CH₂CO₂Me       Me         187       OC(O)NR'       CH₂CH₂NMe₂       Me         188       OC(O)NR'       CH₂CH₂NMe₂       Me         189       OC(O)NR'       2-Chlor-pyridin-5-yl-methy!       Me         190       OC(O)NR'       2-Pyrimidiny!       Me         191       OC(O)NR'       2-Pyrimidiny!       Me         192       OC(O)NR'       2-Pyrimidiny!       Me         193       OC(O)NR'       2-Qyrimidiny!       Me         194       OC(O)NR'       4I       Et         195       OC(O)NR'       H       Et         196       OC(O)NR'       H       Et         199       OC(O)NR'       n-Bu       Et         201       <			•		
180 OC(O)NR' CH₂CH₂F Me 181 OC(O)NR' CF₃ Me 182 OC(O)NR' CH₂CR₃ Me 183 OC(O)NR' CH₂CN Me 184 OC(O)NR' Cyclopropyl Me 185 OC(O)NR' Cyclopropylmethyl Me 186 OC(O)NR' CH₂CO₂Me Me 187 OC(O)NR' CH₂CO₂Me Me 188 OC(O)NR' CH₂CH₂NMe₂ Me 189 OC(O)NR' 2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl Me 190 OC(O)NR' 2-Furanyl Me 191 OC(O)NR' 2-Pyrimidinyl Me 192 OC(O)NR' 2-Oxazolyl Me 193 OC(O)NR' 5-[1,2,4]-oxdiazolyl Me 194 OC(O)NR' Tetrazolyl Me 195 OC(O)NR' Me 196 OC(O)NR' Et 197 OC(O)NR' Et 198 OC(O)NR' I-Pr 199 OC(O)NR' I-Pr 200 OC(O)NR' I-Bu Et 201 OC(O)NR' I-Bu Et 202 OC(O)NR' CH₂C⊒CH Et 203 OC(O)NR' CH₂C⊒CH Et 204 OC(O)NR' CH₂C□CH Et 205 OC(O)NR' CH₂C□CH Et 206 OC(O)NR' CH₂C□CH Et 207 OC(O)NR' CH₂C□CF Et 208 OC(O)NR' CH₂C□CF Et 207 OC(O)NR' CH₂C□CF Et 207 OC(O)NR' CH₂C□CF Et 208 OC(O)NR' CH₂C□CF Et 207 OC(O)NR' CH₂C□CF Et 207 OC(O)NR' CH₂C□CF Et 207 OC(O)NR' CH₂C□CF Et 208 OC(O)NR' CH₂CFS Et					
181 OC(O)NR' CF₃ Me 182 OC(O)NR" CH₂CF₃ Me 183 OC(O)NR' CH₂CN Me 184 OC(O)NR' Cyclopropyl Me 185 OC(O)NR' Cyclopropylmethyl Me 186 OC(O)NR' CH₂CO₂Me Me 187 OC(O)NR' CH₂CO₂Me Me 188 OC(O)NR' CH₂CH₂NMe₂ Me 189 OC(O)NR' 2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl Me 190 OC(O)NR' 2-Furanyl Me 191 OC(O)NR' 2-Pyrimidinyl Me 192 OC(O)NR' 2-Oxazolyl Me 193 OC(O)NR' 5-[1,2,4]-oxdiazolyl Me 194 OC(O)NR' Et 196 OC(O)NR' Et 197 OC(O)NR' Et 198 OC(O)NR' Et 199 OC(O)NR' i-Pr 200 OC(O)NR' i-Pr 200 OC(O)NR' i-Bu Et 201 OC(O)NR' i-Bu Et 202 OC(O)NR' Allyl Et 203 OC(O)NR' CH₂C⊒CH Et 204 OC(O)NR' CH₂CH₂F Et 205 OC(O)NR' CH₂CH₂F Et 206 OC(O)NR' CH₂CF₃ Et 207 OC(O)NR' CH₂CF₃ Et 207 OC(O)NR' CH₂CF₃ Et 207 OC(O)NR' CH₂CF₃ Et 207 OC(O)NR' CH₂CF₃ Et 207 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 207 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 207 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 207 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 207 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 207 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 208 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 207 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 207 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 208 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 207 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 208 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 208 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 207 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 208 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 208 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 208 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 208 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 209 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 200 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 200 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 201 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 202 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 203 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 204 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 205 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 206 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 207 OC(O)NR' CH₂CFъ Et 208 OC(O)NR' CH₂CFъ Et	1	, ,			
182					
183       OC(O)NR'       CH₂CN       Me         184       OC(O)NR'       Cyclopropy!       Me         185       OC(O)NR'       Cyclopropylmethy!       Me         186       OC(O)NR'       CH₂CO₂Me       Me         187       OC(O)NR'       CH₂-(N-morpholiny!)       Me         188       OC(O)NR'       CH₂-(N-morpholiny!)       Me         189       OC(O)NR'       2-Furany!       Me         190       OC(O)NR'       2-Furany!       Me         191       OC(O)NR'       2-Pyrimidiny!       Me         192       OC(O)NR'       2-Oxazoiy!       Me         193       OC(O)NR'       5-[1,2,4]-oxdiazoly!       Me         194       OC(O)NR'       Tetrazoly!       Me         195       OC(O)NR'       H       Et         196       OC(O)NR'       H       Et         197       OC(O)NR'       Et       Et         198       OC(O)NR'       n-Pr       Et         199       OC(O)NR'       n-Bu       Et         201       OC(O)NR'       Ally!       Et         202       OC(O)NR'       CH₂C=CH       Et         204       <	1				
184       OC(O)NR'       Cyclopropy!       Me         185       OC(O)NR'       Cyclopropylmethy!       Me         186       OC(O)NR'       CH₂CO₂Me       Me         187       OC(O)NR'       CH₂CH₂NMe₂       Me         188       OC(O)NR'       CH₂-(N-morpholiny!)       Me         189       OC(O)NR'       2-Chlor-pyridin-5-yl-methy!       Me         190       OC(O)NR'       2-Furany!       Me         191       OC(O)NR'       2-Pyrimidiny!       Me         192       OC(O)NR'       2-Oxazoly!       Me         193       OC(O)NR'       5-[1,2,4]-oxdiazoly!       Me         194       OC(O)NR'       H       Et         195       OC(O)NR'       Me       Et         197       OC(O)NR'       Me       Et         198       OC(O)NR'       I-Pr       Et         199       OC(O)NR'       i-Pr       Et         201       OC(O)NR'       i-Bu       Et         202       OC(O)NR'       CH₂C≡CH       Et         203       OC(O)NR'       CH₂CECH       Et         204       OC(O)NR'       CH₂CECH₂F       Et         205 <td>1</td> <td></td> <td></td> <td></td> <td></td>	1				
$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	4				-
186         OC(O)NR'         CH₂CO₂Me         Me           187         OC(O)NR'         CH₂CH₂NMe₂         Me           188         OC(O)NR'         CH₂-(N-morpholinyl)         Me           189         OC(O)NR'         2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl         Me           190         OC(O)NR'         2-Furanyl         Me           191         OC(O)NR'         2-Pyrimidinyl         Me           192         OC(O)NR'         2-Oxazolyl         Me           193         OC(O)NR'         5-[1,2,4]-oxdiazolyl         Me           194         OC(O)NR'         Tetrazolyl         Me           195         OC(O)NR'         H         Et           196         OC(O)NR'         Me         Et           197         OC(O)NR'         Et         Et           198         OC(O)NR'         n-Pr         Et           199         OC(O)NR'         i-Pr         Et           201         OC(O)NR'         i-Bu         Et           202         OC(O)NR'         Allyl         Et           203         OC(O)NR'         CH <sub>2</sub> C=CH         Et           204         OC(O)NR'         CH <sub>2</sub> C=CH         Et      <					
187				1	
$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	1			1	i
189					
190 OC(O)NR' 2-Furanyl Me 191 OC(O)NR' 2-Pyrimidinyl Me 192 OC(O)NR' 2-Oxazolyl Me 193 OC(O)NR' 5-[1,2,4]-oxdiazolyl Me 194 OC(O)NR' Tetrazolyl Me 195 OC(O)NR' Me 196 OC(O)NR' Me 197 OC(O)NR' Et 198 OC(O)NR' n-Pr 199 OC(O)NR' i-Pr 200 OC(O)NR' i-Pr 200 OC(O)NR' i-Bu 201 OC(O)NR' i-Bu 202 OC(O)NR' Allyl 203 OC(O)NR' CH₂C≡CH 204 OC(O)NR' CH₂CH₂ Et 205 OC(O)NR' CH₂CH₂ Et 206 OC(O)NR' CH₂CH₂ Et 207 OC(O)NR' CH₂CF₃ Et 207 OC(O)NR' CH₂CF₃ 208 OC(O)NR' CH₂CF₃ 208 OC(O)NR' CH₂CF₃ 209 CC(O)NR' CH₂CF₃ 200 OC(O)NR' CH₂CF₃ 201 OC(O)NR' CH₂CF₃ 202 OC(O)NR' CH₂CF₃ 203 OC(O)NR' CH₂CF₃ 204 OC(O)NR' CH₂CF₃ 205 OC(O)NR' CH₂CF₃ 206 OC(O)NR' CH₂CF₃ 207 OC(O)NR' CH₂CF₃ 208 OC(O)NR' CH₂CF₃ 208 OC(O)NR' CH₂CRS		1			
191 OC(O)NR' 2-Pyrimidinyl Me 192 OC(O)NR' 2-Oxazolyl Me 193 OC(O)NR' 5-[1,2,4]-oxdiazolyl Me 194 OC(O)NR' Tetrazolyl Me 195 OC(O)NR' Me 196 OC(O)NR' Me 197 OC(O)NR' Et Et 198 OC(O)NR' n-Pr 199 OC(O)NR' i-Pr 200 OC(O)NR' i-Pr 200 OC(O)NR' n-Bu Et 201 OC(O)NR' i-Bu Et 202 OC(O)NR' Allyl Et 203 OC(O)NR' CH₂C≡CH Et 204 OC(O)NR' CH₂C=CH 205 OC(O)NR' CH₂CF 206 OC(O)NR' CH₂CF 207 OC(O)NR' CH₂CF 208 OC(O)NR' CH₂CF 208 OC(O)NR' CH₂CF 208 OC(O)NR' CH₂CF 209 CC(O)NR' CH₂CF 200 OC(O)NR' CH₂CF					
192 OC(O)NR' 2-Oxazolyl Me 193 OC(O)NR' 5-[1,2,4]-oxdiazolyl Me 194 OC(O)NR' Tetrazolyl Me 195 OC(O)NR' H 196 OC(O)NR' Me 197 OC(O)NR' Et 198 OC(O)NR' I-Pr 199 OC(O)NR' i-Pr 200 OC(O)NR' i-Pr 200 OC(O)NR' i-Bu 201 OC(O)NR' i-Bu 202 OC(O)NR' Allyl Et 203 OC(O)NR' Allyl Et 204 OC(O)NR' CH₂C≡CH 205 OC(O)NR' CH₂CH₂ Et 206 OC(O)NR' CH₂CH₂F 206 OC(O)NR' CH₂CF₃ Et 207 OC(O)NR' CH₂CF₃ 208 OC(O)NR' CH₂CF₃ 208 OC(O)NR' CH₂CR₃ 209 CC(O)NR' CH₂CF₃ 200 OC(O)NR' CH₂CF₃ 201 CH₂CR₃ 202 OC(O)NR' CH₂CF₃ 203 CO(O)NR' CH₂CF₃ 204 OC(O)NR' CH₂CF₃ 205 CO(O)NR' CH₂CF₃ 206 OC(O)NR' CH₂CF₃ 207 OC(O)NR' CH₂CR₃ 208 OC(O)NR' CH₂CR₃ 209 CO(O)NR' CH₂CR₃ 200 CO(O)NR' CH₂CR₃					
193					
194 OC(O)NR' Tetrazolyl Me  195 OC(O)NR' H  196 OC(O)NR' Me  197 OC(O)NR' Et  198 OC(O)NR' n-Pr  199 OC(O)NR' i-Pr  200 OC(O)NR' n-Bu  201 OC(O)NR' i-Bu  202 OC(O)NR' Allyl  203 OC(O)NR' Allyl  204 OC(O)NR' CH₂C≡CH  205 OC(O)NR' CH₂CH₂F  206 OC(O)NR' CH₂CF₃  207 OC(O)NR' CH₂CF₃  208 OC(O)NR' CH₂CR  209 OC(O)NR' CH₂CF₃  200 CC(O)NR' CH₂CF₃  201 CH₂CF₃  202 CC(O)NR' CH₂CF₃  203 CC(O)NR' CH₂CF₃  204 CC(O)NR' CH₂CF₃  205 CC(O)NR' CH₂CF₃  206 CC(O)NR' CH₂CF₃  207 CC(O)NR' CH₂CF₃  208 CC(O)NR' CH₂CR  209 CC(O)NR' CH₂CF₃  200 CC(O)NR' CH₂CF₃  200 CC(O)NR' CH₂CF₃  200 CC(O)NR' CH₂CF₃  200 CC(O)NR' CH₂CF₃  200 CC(O)NR' CH₂CF₃  200 CC(O)NR' CH₂CF₃  200 CC(O)NR' CH₂CF₃  200 CC(O)NR' CH₂CF₃  200 CC(O)NR' CH₂CR			•		
195 OC(O)NR' H 196 OC(O)NR' Me 197 OC(O)NR' Et 198 OC(O)NR' n-Pr 199 OC(O)NR' i-Pr 200 OC(O)NR' n-Bu 201 OC(O)NR' i-Bu 202 OC(O)NR' i-Bu 203 OC(O)NR' Allyl 204 OC(O)NR' CH₂C≡CH 205 OC(O)NR' CH2C≡CH 206 OC(O)NR' CH2CH₂F 207 OC(O)NR' CH₂CF₃ 208 OC(O)NR' CH₂CF₃ 208 OC(O)NR' CH₂CR 208 OC(O)NR' CH₂CR 209 CH₂CR 200 CH₂C			,		
196 $OC(O)NR'$ $Me$ $Et$ 197 $OC(O)NR'$ $Et$ $Et$ 198 $OC(O)NR'$ $n-Pr$ $Et$ 199 $OC(O)NR'$ $i-Pr$ $Et$ 200 $OC(O)NR'$ $n-Bu$ $Et$ 201 $OC(O)NR'$ $i-Bu$ $Et$ 202 $OC(O)NR'$ $CH_2C \equiv CH$ $Et$ 203 $OC(O)NR'$ $CH_2C \equiv CH$ $Et$ 204 $OC(O)NR'$ $CH=CH_2$ $Et$ 205 $OC(O)NR'$ $CH_2CH_2F$ $Et$ 206 $OC(O)NR'$ $CF_3$ $Et$ 207 $OC(O)NR''$ $CH_2CF_3$ $Et$ 208 $OC(O)NR'$ $CH_2CN$ $CH_2CN$					<u> </u>
197 $OC(O)NR'$ $Et$ $Et$ 198 $OC(O)NR'$ $n-Pr$ $Et$ 199 $OC(O)NR'$ $i-Pr$ $Et$ 200 $OC(O)NR'$ $n-Bu$ $Et$ 201 $OC(O)NR'$ $i-Bu$ $Et$ 202 $OC(O)NR'$ $Allyl$ $Et$ 203 $OC(O)NR'$ $CH_2C=CH$ $Et$ 204 $OC(O)NR'$ $CH=CH_2$ $Et$ 205 $OC(O)NR'$ $CH_2CH_2F$ $Et$ 206 $OC(O)NR'$ $CF_3$ $Et$ 207 $OC(O)NR''$ $CH_2CF_3$ $Et$ 208 $OC(O)NR'$ $CH_2CN$ $CH_2CN$	195	OC(O)NR'	H	Et	
198 $OC(O)NR'$ $n-Pr$ $Et$ 199 $OC(O)NR'$ $i-Pr$ $Et$ 200 $OC(O)NR'$ $n-Bu$ $Et$ 201 $OC(O)NR'$ $i-Bu$ $Et$ 202 $OC(O)NR'$ $Allyl$ $Et$ 203 $OC(O)NR'$ $CH_2C=CH$ $Et$ 204 $OC(O)NR'$ $CH=CH_2$ $Et$ 205 $OC(O)NR'$ $CH_2CH_2F$ $Et$ 206 $OC(O)NR'$ $CF_3$ $Et$ 207 $OC(O)NR''$ $CH_2CF_3$ $Et$ 208 $OC(O)NR'$ $CH_2CN$ $CH_2CN$	196	OC(O)NR'	Me	Et	
199 OC(O)NR' i-Pr 200 OC(O)NR' n-Bu 201 OC(O)NR' i-Bu 202 OC(O)NR' Allyl 203 OC(O)NR' CH₂C≡CH 204 OC(O)NR' CH=CH₂ 205 OC(O)NR' CH₂CH₂F 206 OC(O)NR' CF₃ 207 OC(O)NR' CH₂CF₃ 208 OC(O)NR' CH₂CN Et Et CH₂CF₃ Et CH₂CF₃ Et CH₂CF₃ Et CH₂CF₃ Et CH₂CF₃ Et CH₂CR Et	197		Et	Et	
$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	198	OC(O)NR'	l .	Et	
$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	199	OC(O)NR'	i-Pr	Et	
$ \begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	200	OC(O)NR'	n-Bu	Et	
$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	201	OC(O)NR'	i-Bu	Et	
$ \begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	202	OC(O)NR'	Allyi	Et	
	203	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> C≡CH	Et	
205 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F Et 206 OC(O)NR' CF <sub>3</sub> Et 207 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et 208 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CN Et	204	OC(O)NR'		Et	
206   OC(O)NR'   CF <sub>3</sub>   Et	205			Et	
207 OC(O)NR" CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> Et CH <sub>2</sub> CN Et	206			Et	1
208 OC(O)NR' CH <sub>2</sub> CN Et	3			•	
	208			1	
	209	OC(O)NR'	Cyclopropyl	Et	[

WO 00/35913

Bsp. Nr.   Y
211 OC(O)NR' CH₂CO₂Me Et Et 212 OC(O)NR' CH₂CH₂NMe₂ Et Et 213 OC(O)NR' CH₂-(N-morpholinyl) Et 214 OC(O)NR' 2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl Et 215 OC(O)NR' 2-Furanyl Et 216 OC(O)NR' 2-Pyrimidinyl Et 217 OC(O)NR' 2-Pyrimidinyl Et 218 OC(O)NR' 5-[1,2,4]-oxdiazolyl Et 219 OC(O)NR' Tetrazolyl Et 219 OC(O)C(O)O H Et 221 OC(O)C(O)O Et 222 OC(O)C(O)O Et 223 OC(O)C(O)O i-Pr 225 OC(O)C(O)O i-Bu 226 OC(O)C(O)O i-Bu 227 OC(O)C(O)O i-Bu 227 OC(O)C(O)O CH₂C≡CH 229 OC(O)C(O)O CH₂C≡CH 229 OC(O)C(O)O CH₂C≡CH 229 OC(O)C(O)O CH₂C□CH 229 OC(O)C(O)O CH₂C□CH 229 OC(O)C(O)O CH₂C□CH 231 OC(O)C(O)O CH₂C□CH 231 OC(O)C(O)O CH₂C□CH 232 OC(O)C(O)O CH₂C□CH 233 OC(O)C(O)O CH₂C□CH 234 OC(O)C(O)O CH₂C□CH 235 OC(O)C(O)O CH₂C□CH 236 OC(O)C(O)O CH₂C□CH 237 OC(O)C(O)O CH₂C□CH 238 OC(O)C(O)O CH₂C□CH 238 OC(O)C(O)O CH₂C□CO₂Me 238 OC(O)C(O)O CH₂C□CO₂Me 238 OC(O)C(O)O CH₂C□CO₂Me 239 OC(O)C(O)O CH₂CH₂NMe₂ 239 OC(O)C(O)O 2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl 240 OC(O)C(O)O 2-Furanyl
212
213
214 OC(O)NR' 2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl Et 215 OC(O)NR' 2-Furanyl Et 216 OC(O)NR' 2-Pyrimidinyl Et 217 OC(O)NR' 2-Oxazolyl Et 218 OC(O)NR' 5-[1,2,4]-oxdiazolyl Et 219 OC(O)NR' Tetrazolyl Et 219 OC(O)C(O)O H 221 OC(O)C(O)O H 222 OC(O)C(O)O H 223 OC(O)C(O)O i-Pr 224 OC(O)C(O)O i-Pr 225 OC(O)C(O)O i-Bu 227 OC(O)C(O)O i-Bu 228 OC(O)C(O)O CH₂C≡CH 229 OC(O)C(O)O CH₂CECH 229 OC(O)C(O)O CH₂CH₂C 231 OC(O)C(O)O CH₂CH₂C 231 OC(O)C(O)O CH₂CH₂C 231 OC(O)C(O)O CH₂CH₂C 231 OC(O)C(O)O CH₂CH₂C 231 OC(O)C(O)O CH₂CH₂C 231 OC(O)C(O)O CH₂CH₂C 231 OC(O)C(O)O CH₂CH₂C 231 OC(O)C(O)O CH₂CH₂C 231 OC(O)C(O)O CH₂CH₂C 231 OC(O)C(O)O CH₂CH₂C 231 OC(O)C(O)O CH₂CH₂C 231 OC(O)C(O)O CH₂CH₂C 231 OC(O)C(O)O CH₂CH₂C 232 OC(O)C(O)O CH₂CH₂CN 235 OC(O)C(O)O CH₂CN 235 OC(O)C(O)O CH₂CN 236 OC(O)C(O)O CH₂CN 237 OC(O)C(O)O CH₂CH₂CN 238 OC(O)C(O)O CH₂CCD₂Me 238 OC(O)C(O)O CH₂CCD₂Me 239 OC(O)C(O)O CH₂CH₂NMe₂ 239 OC(O)C(O)O CH₂-CN-morpholinyl) 2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl 241 OC(O)C(O)O 2-Furanyl
215         OC(O)NR'         2-Furanyl         Et           216         OC(O)NR'         2-Pyrimidinyl         Et           217         OC(O)NR'         2-Oxazolyl         Et           218         OC(O)NR'         5-[1,2,4]-oxdiazolyl         Et           219         OC(O)C(O)O         H         Et           220         OC(O)C(O)O         H         Me           221         OC(O)C(O)O         H         Me           222         OC(O)C(O)O         Et         Tetrazolyl         Et           223         OC(O)C(O)O         H         Me         Et           224         OC(O)C(O)O         Et         n-Pr         Image: Property of the property
216
217 OC(O)NR' 2-Oxazolyl Et 218 OC(O)NR' 5-[1,2,4]-oxdiazolyl Et 219 OC(O)NR' Tetrazolyl Et 219 OC(O)C(O)O H 221 OC(O)C(O)O Et 222 OC(O)C(O)O Et 223 OC(O)C(O)O i-Pr 224 OC(O)C(O)O i-Pr 225 OC(O)C(O)O i-Bu 227 OC(O)C(O)O Allyl 228 OC(O)C(O)O CH₂C≡CH 229 OC(O)C(O)O CH₂C=CH 229 OC(O)C(O)O CH₂C=CH 231 OC(O)C(O)O CH₂CF₃ 231 OC(O)C(O)O CH₂CF₃ 232 OC(O)C(O)O CH₂CF₃ 234 OC(O)C(O)O CH₂CF₃ 235 OC(O)C(O)O CH₂CF₃ 236 OC(O)C(O)O CH₂CF₃ 237 OC(O)C(O)O Cyclopropyl 236 OC(O)C(O)O Cyclopropyl 237 OC(O)C(O)O CH₂CO₂Me 238 OC(O)C(O)O CH₂CO₂Me 239 OC(O)C(O)O CH₂CH₂NMe₂ 239 OC(O)C(O)O CH₂-(N-morpholinyl) 240 OC(O)C(O)O 2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl 241 OC(O)C(O)O 2-Furanyl
218
219         OC(O)NR'         Tetrazolyl         Et           220         OC(O)C(O)O         H           221         OC(O)C(O)O         Me           222         OC(O)C(O)O         Et           223         OC(O)C(O)O         n-Pr           224         OC(O)C(O)O         i-Pr           225         OC(O)C(O)O         n-Bu           226         OC(O)C(O)O         Allyl           227         OC(O)C(O)O         CH₂C≡CH           229         OC(O)C(O)O         CH=CH₂           230         OC(O)C(O)O         CF₃           231         OC(O)C(O)O         CH₂CF₃           234         OC(O)C(O)O         CH₂CR₂           235         OC(O)C(O)O         Cyclopropyl           236         OC(O)C(O)O         CH₂CO₂Me           237         OC(O)C(O)O         CH₂CN₂Me₂           238         OC(O)C(O)O         CH₂-(N-morpholinyl)           240         OC(O)C(O)O         2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl           241         OC(O)C(O)O         2-Furanyl
220         OC(O)C(O)O         H           221         OC(O)C(O)O         Me           222         OC(O)C(O)O         Et           223         OC(O)C(O)O         n-Pr           224         OC(O)C(O)O         i-Pr           225         OC(O)C(O)O         n-Bu           226         OC(O)C(O)O         Allyl           227         OC(O)C(O)O         CH₂C≡CH           228         OC(O)C(O)O         CH=CH₂           230         OC(O)C(O)O         CH₂CH₂F           231         OC(O)C(O)O         CH₂CF₃           232         OC(O)C(O)O         CH₂CF₃           234         OC(O)C(O)O         CH₂CN           235         OC(O)C(O)O         Cyclopropyl           236         OC(O)C(O)O         CH₂CO₂Me           237         OC(O)C(O)O         CH₂CH₂NMe₂           238         OC(O)C(O)O         CH₂-(N-morpholinyl)           240         OC(O)C(O)O         2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl           241         OC(O)C(O)O         2-Furanyl
221         OC(O)C(O)O         Me           222         OC(O)C(O)O         Et           223         OC(O)C(O)O         n-Pr           224         OC(O)C(O)O         i-Pr           225         OC(O)C(O)O         n-Bu           226         OC(O)C(O)O         Allyl           227         OC(O)C(O)O         CH₂C≡CH           228         OC(O)C(O)O         CH₂CH₂F           229         OC(O)C(O)O         CH₂CH₂F           231         OC(O)C(O)O         CF₃           232         OC(O)C(O)O         CH₂CF₃           234         OC(O)C(O)O         Cyclopropyl           235         OC(O)C(O)O         Cyclopropylmethyl           237         OC(O)C(O)O         CH₂CO₂Me           238         OC(O)C(O)O         CH₂-(N-morpholinyl)           239         OC(O)C(O)O         CH₂-(N-morpholinyl)           240         OC(O)C(O)O         2-Furanyl
$ \begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$
$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$
OC(O)C(O)O
225         OC(O)C(O)O         n-Bu           226         OC(O)C(O)O         i-Bu           227         OC(O)C(O)O         Allyl           228         OC(O)C(O)O         CH₂C≡CH           229         OC(O)C(O)O         CH=CH₂           230         OC(O)C(O)O         CH₂CH₂F           231         OC(O)C(O)O         CH₂CF₃           232         OC(O)C(O)O         CH₂CS₃           234         OC(O)C(O)O         Cyclopropyl           235         OC(O)C(O)O         Cyclopropylmethyl           237         OC(O)C(O)O         CH₂CO₂Me           238         OC(O)C(O)O         CH₂CH₂NMe₂           239         OC(O)C(O)O         CH₂-(N-morpholinyl)           240         OC(O)C(O)O         2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl           241         OC(O)C(O)O         2-Furanyl
$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$
$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$
$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$
229         OC(O)C(O)O         CH=CH2           230         OC(O)C(O)O         CH2CH2F           231         OC(O)C(O)O         CF3           232         OC(O)C(O)O         CH2CF3           234         OC(O)C(O)O         Cyclopropyl           235         OC(O)C(O)O         Cyclopropylmethyl           236         OC(O)C(O)O         CH2CO2Me           237         OC(O)C(O)O         CH2CH2NMe2           238         OC(O)C(O)O         CH2-(N-morpholinyl)           240         OC(O)C(O)O         2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl           241         OC(O)C(O)O         2-Furanyl
$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$
231 OC(O)C(O)O CF <sub>3</sub> 232 OC(O)C(O)O CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> 234 OC(O)C(O)O CH <sub>2</sub> CN 235 OC(O)C(O)O Cyclopropyl 236 OC(O)C(O)O Cyclopropylmethyl 237 OC(O)C(O)O CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me 238 OC(O)C(O)O CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> 239 OC(O)C(O)O CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl) 240 OC(O)C(O)O 2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl 241 OC(O)C(O)O 2-Furanyl
$ \begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$
234 OC(O)C(O)O CH <sub>2</sub> CN 235 OC(O)C(O)O Cyclopropyl 236 OC(O)C(O)O Cyclopropylmethyl 237 OC(O)C(O)O CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me 238 OC(O)C(O)O CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> 239 OC(O)C(O)O CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl) 240 OC(O)C(O)O 2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl 241 OC(O)C(O)O 2-Furanyl
235 OC(O)C(O)O Cyclopropyl 236 OC(O)C(O)O Cyclopropylmethyl 237 OC(O)C(O)O CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me 238 OC(O)C(O)O CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> 239 OC(O)C(O)O CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl) 240 OC(O)C(O)O 2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl 241 OC(O)C(O)O 2-Furanyl
236
237 OC(O)C(O)O CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me 238 OC(O)C(O)O CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> 239 OC(O)C(O)O CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl) 240 OC(O)C(O)O 2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl 241 OC(O)C(O)O 2-Furanyl
238
239 OC(O)C(O)O CH₂-(N-morpholinyl) 240 OC(O)C(O)O 2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl 241 OC(O)C(O)O 2-Furanyl
240
241 OC(O)C(O)O   2-Furanyl
242   OC(O)C(O)O   2-Pvrimidinv
1 - ( - ) - ( - ) - ( - ) - ( - )
243 OC(O)C(O)O 2-Oxazolyl
244 OC(O)C(O)O 5-[1,2,4]-oxdiazolyl
245 OC(O)C(O)O Tetrazolyl
246 S(O)₂NR' H
247  S(O)₂NR'  Me  H
248  S(O)₂NR'  Et  H
249   S(O)₂NR'   n-Pr
250  S(O)₂NR'  i-Pr   H
251 S(O)₂NR' n-Bu H
252   S(O)₂NR'   i-Bu
253 S(O)₂NR' Allyl H
254 S(O) <sub>2</sub> NR' CH <sub>2</sub> C≡CH H
255 S(O)₂NR' CH=CH₂ H
256 S(O) <sub>2</sub> NR' CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F H
257 S(O) <sub>2</sub> NR' CF <sub>3</sub> H
258 S(O) <sub>2</sub> NR' CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub> H
259 S(O) <sub>2</sub> NR' CH <sub>2</sub> CN H

MINDOOID 440 MSEN13A1 I -

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
260	S(O)₂NR'	Cyclopropyl	Н	
261	S(O)₂NR'	Cyclopropylmethyl	н	
262	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Н	
263	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	H .	
264	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	н	
265	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	н	
266	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Furanyl	н	
267	S(O)₂NR'	2-Pyrimidinyl	н	
268	S(O)₂NR'	2-Oxazolyl	н	
269	S(O) <sub>2</sub> NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Н	ĺ
270	S(O) <sub>2</sub> NR'	Tetrazolyl	Н	
271	S(O) <sub>2</sub> NR'	Н	Me	
272	S(O) <sub>2</sub> NR'	Me	Ме	
273	S(O) <sub>2</sub> NR'	Et	Ме	
274	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Pr	Ме	i
275	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Pr	Ме	
276	S(O)₂NR'	n-Bu	Ме	i
277	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Bu	Ме	
278	S(O) <sub>2</sub> NR'	Aliyi	Ме	l
279	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH₂C≡CH	Ме	
280	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Ме	
281	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Me	
282	S(O) <sub>2</sub> NR'	CF <sub>3</sub>	Me	
283	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
284	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH₂CN	Me	
285	S(O)₂NR'	Cyclopropyl	Me	
286	S(O) <sub>2</sub> NR'	Cyclopropylmethyl	Me	Ì
287	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Me	
288	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Me	[
289	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Ме	
289	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Ме	1
290	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Furanyl	Me	]
291	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Pyrimidinyl	Me	
292	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Oxazolyl	Me	
293	S(O) <sub>2</sub> NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Me	l
294	S(O)₂NR'	Tetrazolyl	Me	
295	S(O) <sub>2</sub> NR'	Н	Et	<del> </del>
296	S(O) <sub>2</sub> NR'	Me	Et	
297	S(O) <sub>2</sub> NR'	Et	Et	ļ
298	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Pr	Et	Ì
299	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Pr	Et	
300	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Bu	Et	1
301	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Bu	Et	
302	S(O) <sub>2</sub> NR'	Allyl	Et	1
303	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH₂C≡CH	Et	
304	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Et	1
305	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Et	
306	S(O) <sub>2</sub> NR'	CF <sub>3</sub>	Et	
307	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Et	
<u> </u>	- ( - /2	1		

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
308	S(O)₂NR'	CH₂CN	Et	
309	S(O)₂NR'	Cyclopropyl	Et	
310	S(O)₂NR'	Cyclopropylmethyl	Et	
311	S(O)₂NR'	CH₂CO₂Me	Et	
312	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Et	
313	S(O)₂NR'	CH₂-(N-morpholinyl)	Et	
314	S(O)₂NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Et	
315	S(O)₂NR'	2-Furanyl	Et	
316	S(O)₂NR'	2-Pyrimidinyl	Et	
317	S(O)₂NR'	2-Oxazolyi	Et	
318	S(O)₂NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Et	
319	S(O) <sub>2</sub> NR'	Tetrazolyl	Et	

Tabelle 2:

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
1	0	H		128
2	0	Et		Öl
2	o	n-Pr		
4	О	i-Pr		Öl
4 5 6	0	n-Bu	Į	Öl
6	0	i-Bu		Öl
7	0	Allyl		Öl
8	0	CH₂C≡CH		ÖI
9	0	CH=CH <sub>2</sub>		
10	0	CH₂CH₂F		
11	0	CF <sub>3</sub>		
12	0	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		Öı
13	lo	CH₂CN		-
14	o .	Cyclopropyl		
15	o	Cyclopropylmethyl	i .	ÖI
16	lo	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		
17	o	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
18	lo	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		ÖI
19	o	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
20	lo	2-Furanyl	1	
21	lo	2-Pyrimidinyl		
22	o	2-Oxazolyl		
23	ő	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
24	0	Tetrazolyl		
25	o	1,3-Oxindol-2-yl		ÖI
26	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	į	Ö
27	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OMe	1	Öi
28	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	ļ	Öi
29	S	H	<del>                                     </del>	<u> </u>
30	ls	Et		ÖI
31	s	n-Pr		Öi
32	S	li-Pr		,
33	S	n-Bu		
34	S	i-Bu		ÖI
35	S	Allyi		Ö
36	S	CH <sub>2</sub> C≡CH		51
37	S	CH <sub>2</sub> C≅CH CH=CH <sub>2</sub>		
38	S			
39	9	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		ÖI
40	S S	CF <sub>3</sub>	1	Ö
	S	CH₂CF₃		ال
41	10	CH₂CN	Ī	1

Bsp. Nr.	Y	R	R'	m.p. [°C]
42		Cyclopropyl	<del>                                     </del>	p. [ Oj
43	6			
44	3	Cyclopropylmethyl		Д,
	0	CH₂CO₂Me	l	Öl
45	S	CH₂CO₂Et	ļ	Öl
46	S	CH₂CH₂CO₂Me		Öl
47	00000000000000000000000000000000000000	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
48	S	CH₂-(N-morpholinyl)		
49	S	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
50	S	2-Furanyl		
51	S	2-Pyridinyl		Öl
52	S	2-Pyrimidinyl		kristallin
53	S	2-Oxazolyl		
54	s	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
55	S	Tetrazolyl		
56	s	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH		Öl
57	S	Ac		ÖI
		ÇF <sub>3</sub>		Ì
		J' 3		
58	s	.N	1	
30	١	CH <sub>2</sub> — \\		
		N		į
		N—O		
			<u> </u>	
59	NR'	('		136
39	INK	<u> </u>		130
		(0)		i
60	NR'C(O)O	CMe <sub>3</sub>	Н	Öl
	1111 0(0)0	Olvie3		0.
	[	CE CE	1	
		CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		
61	ND'	) / N	CO alled	Öı
61	INR'	N N	CO <sub>2</sub> allyl	
		'``o'		[
				Į į
		N'	1	
			1	
62	NR'SO <sub>2</sub>	C(H)Cl <sub>2</sub>	Ме	ÖI
63	NR'SO <sub>2</sub>	Bu	Me	Öl
64	NR'SO <sub>2</sub>	Pr	Me	Öi
65	S	N-Me-imidazol-2-yl	<del> </del>	fest
66	s	[1,2,4]-triazol-3-yl		fest
67	S	4-Me-[1,2,4]-triazol-3-yl		kristallin
68	S	4-Me-tetrazol-5-yl		fest
69	S			
70	S	2-Thiazolin-2-yl	1	kristallin
	13	Cyclohexyl	<u> </u>	Wachs
71	S(O)	Et	1	

Bsp. Nr.	Y	R	R'	m.p. [°C]
72	S(O)	n-Pr		
73	S(O)	i-Pr	Ì	Öl
74	S(O)	n-Bu		
75	S(O)	i-Bu	1	
76	S(O)	Allyl		
77	S(O)	CH₂C≡CH		
78	S(O)	CH=CH <sub>2</sub>	j	
79	S(O)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	1	
80	S(O)	CF <sub>3</sub>		fest
1				129
81	S(O)	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1	123
82	S(O)	CH₂CN	1	
83	S(O)	Cyclopropyl	}	
84	S(O)	Cyclopropylmethyl		1
85	S(O)	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		
86	S(O)	CH₂CH₂NMe₂		
87	S(O)	CH₂-(N-morpholinyl)		
88	S(O)	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
89	S(O)	2-Furanyl		
90	S(O)	2-Pyrimidinyl		
91	S(O)	2-Oxazolyl		!
92	S(O)	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	ł	
93	S(O)	Tetrazolyl	<u> </u>	
94	S(O) <sub>2</sub>	Me		92
95	S(O)₂	Et	· I	
96	S(O)₂	n-Pr		73
97	S(O) <sub>2</sub>	i-Pr		109
98	S(O) <sub>2</sub>	n-Bu		
99	S(O) <sub>2</sub>	n-Hex		87
100	S(O) <sub>2</sub>	i-Bu	İ	
101	S(O) <sub>2</sub>	Allyl	Ì	
102	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> C≡CH	1	
103	S(O) <sub>2</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	1	
104	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	1	
105	S(O) <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	i	
106	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		kristallin
107	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN	1	
1.00	S(O) <sub>2</sub>	Cyclopropyi	į	,
108	S(O) <sub>2</sub>	Cyclopropylmethyl	į	
1109	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	1	
I .		CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> wie CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
111	S(O) <sub>2</sub>			
112	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	1	
113	S(O) <sub>2</sub>	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
114	S(O) <sub>2</sub>	2-Furanyl		99
115	S(O) <sub>2</sub>	2-Furfuryl		100
116	S(O) <sub>2</sub>	2-Thienyl	- }	100
117	S(O) <sub>2</sub>	2-Pyrimidinyl		
118	S(O) <sub>2</sub>	2-Oxazolyl		
119	S(O)₂	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	ļ	
120	S(O) <sub>2</sub>	Tetrazolyl	1	
121	S(O)₂	ONa		214
122	S(O) <sub>2</sub>	p-F-benzyl		156

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
123	OC(O)	Н		
124	OC(O)	Me		
125	OC(O)	Et		ÖI
126	OC(O)	n-Pr		
127	OC(O)	i-Pr		
128	OC(O)	n-Bu		
129	OC(O)	i-Bu		öı
130	oc(o)	t-Bu		Öl
131	oc(o)	Allyl		-
132	oc(o)	CH₂C≡CH		
133	oc(o)	CH=CH <sub>2</sub>		Öl
134	oc(o)	CH₂CH₂F		
135	oc(o)	CF <sub>3</sub>		
136	oc(o)	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		
137	oc(o)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SiMe <sub>3</sub>		Öl
138	oc(o)	CH <sub>2</sub> CN	:	Öl
139	00(0)	Cyclopropyl	ľ	
140	oc(o)	Cyclopropylmethyl	ļ	
141	oc(o)	CH₂CO₂Me		Öl
142	oc(o)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
143	oc(o)	CH₂OMe		
144	oc(o) .	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	1	
145	oc(o)	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
146	oc(o)	2-Furanyl		
147	oc(o)	2-Pyrimidinyl		
148	oc(o)	2-Oxazolyl		
149	oc(o)	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	1	
150	oc(o)	Tetrazolyl		
151	oc(o)	2-Oxo-pyrrolidin-5-yl		Öl
152	OC(O)O	H		
153	oc(o)o	Me		Öl
154	oc(o)o	Et		Öl
155	oc(o)o	n-Pr		Öl
156	oc(o)o	i-Pr		
157	oc(o)o	n-Bu		
158	00(0)0	i-Bu		
159	oc(o)o	Allyl		
160	00(0)0	CH₂C≡CH		
161	00(0)0	CH=CH <sub>2</sub>		
162	oc(o)o	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		
163	00(0)0	CF <sub>3</sub>		
164	00(0)0	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		
165	00(0)0	CH₂CN		
166				
167				]
168				
169				
170				
171		2-Chlor-pyridin-5-vl-methyl		
172				
173				<b>!</b>
166 167 168 169 170 171	OC(O)O OC(O)O OC(O)O OC(O)O OC(O)O OC(O)O	CH <sub>2</sub> CN Cyclopropyl Cyclopropylmethyl CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl) 2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl 2-Pyrimidinyl		

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
174	OC(O)O	2-Oxazolyl		
175	00(0)0	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	}	
176	00(0)0	Tetrazolyl		
177	OC(O)NR'	H	Н	
178	OC(O)NR'	Ме	Н	
179	OC(O)NR'	Et	н	
180	OC(O)NR'	n-Pr	Н	
181	OC(O)NR'	i-Pr	Н	
182	OC(O)NR'	n-Bu	Н	
183	OC(O)NR'	i-Bu	Н	1
184	OC(O)NR'	Allyl	Н	
185	OC(O)NR'	CH,C≡CH	Н	
186	OC(O)NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Н	
187	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Н	
188	OC(O)NR'	CF <sub>3</sub>	н	]
189	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Н	
190	OC(O)NR'	CH₂CN	Н	
191	OC(O)NR'	Cyclopropyl	]н	
192	OC(O)NR'	Cyclopropylmethyl	н	
193	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	H	
194	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Н	
195	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Н	]
196	OC(O)NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Н	
197	OC(O)NR'	2-Furanyl	Н	1
198	OC(O)NR'	2-Pyrimidinyl	Н	
199	OC(O)NR'	2-Oxazolyl	Н	
200	OC(O)NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	H	
201	OC(O)NR'	Tetrazolyl	H	
202	OC(O)NR'	Н	Ме	
203	OC(O)NR'	Ме	Me	ÖI
204	OC(O)NR'	Et	Me	
205	OC(O)NR'	n-Pr	Me	
206	OC(O)NR'	i-Pr	Me	İ
207	OC(O)NR'	n-Bu	Me	
208	OC(O)NR'	i-Bu	Me	
209	OC(O)NR'	Allyl	Me	
210	OC(O)NR'	CH₂C≡CH	Me	
211	OC(O)NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Ме	
212	OC(O)NR'	CH₂CH₂F	Me	
213	OC(O)NR'	CF <sub>3</sub>	Me	
214	OC(O)NR'	CH₂CF₃	Me	
215	OC(O)NR'	CH₂CN	Ме	
216	OC(O)NR'	Cyclopropyl	Ме	
217	OC(O)NR'	Cyclopropylmethyl	Me	
218	OC(O)NR'	CH₂CO₂Me	Me	
219	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Me	
220	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Me	
221	OC(O)NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Me	
222	OC(O)NR'	2-Furanyl	Me	
223	OC(O)NR'	2-Pyrimidinyl	Me	
224	OC(O)NR'	2-Oxazolyl	Me	1

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
225	OC(O)NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Me	
226	OC(O)NR'	Tetrazolyl	Me	!
227	OC(O)NR'	n-Hex	Ме	
228	OC(O)NR'	Н	Et	
229	OC(O)NR'	Me	Et	
230	OC(O)NR'	Et	Et	
231	OC(O)NR'	n-Pr	Et	
232	OC(O)NR'	i-Pr	Et	
233	OC(O)NR'	n-Bu	Et	
234	OC(O)NR'	i-Bu	Et	Ì
235	, , ,	Allyl .	Et	
15	OC(O)NR'	_		
236	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> C≡CH	Et	
237	OC(O)NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Et	
238	OC(O)NR'	CH₂CH₂F	Et	
239	OC(O)NR'	CF <sub>3</sub>	Et	
240	OC(O)NR'	CH₂CF₃	Et	1
241	OC(O)NR'	CH₂CN	Et	]
242	OC(O)NR'	Cyclopropyl	Et	
243	OC(O)NR'	Cyclopropylmethyl	Et	
244	OC(O)NR'	CH₂CO₂Me	Et	
245	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Et	
246	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Et	
247	OC(O)NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Et	
248	OC(O)NR'	2-Furanyl	Et ·	•
249	OC(O)NR'	2-Pyrimidinyl	Et	
250	OC(O)NR'	2-Oxazolyl	Et	
251	OC(O)NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Et	
252	OC(0)NR'	Tetrazolyl	Et	
253	OC(0)NR'	H	Et	
254	00(0)0(0)0	Н		
255	00(0)0(0)0	Me	Ì	Öl
256	00(0)0(0)0	Et		Öi
257	00(0)0(0)0	n-Pr		
258	00(0)0(0)0	li-Pr		
259	00(0)0(0)0	n-Bu		
260	00(0)0(0)0	i-Bu		
261	00(0)0(0)0	Allyl		
262		1 *		
263	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> C≡CH		
264	00(0)0(0)0	CH=CH <sub>2</sub>		
1	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		
265	00(0)0(0)0	CF <sub>3</sub>		
266	0C(0)C(0)0	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1	
267	0C(0)C(0)0	CH₂CN		
268	00(0)0(0)0	Cyclopropyl		
269	0C(0)C(0)0	Cyclopropylmethyl	1	
270	OC(O)C(O)O	CH₂CO₂Me		
271	00(0)0(0)0	CH₂CH₂NMe₂		
272	00(0)0(0)0	CH₂-(N-morpholinyl)	1	
273	OC(O)C(O)O	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
274	OC(O)C(O)O	2-Furanyi		
275	OC(O)C(O)O	2-Pyrimidinyl	1	

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
276	OC(0)C(0)O	2-Oxazolyl		
277	00(0)0(0)0	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
278	00(0)0(0)0	Tetrazolyl		
279	S(O) <sub>2</sub> NR'	Н	Н	
280	S(O) <sub>2</sub> NR'	Ме	Н	
281	S(O) <sub>2</sub> NR'	Et	н	
282	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Pr	н	]
283	S(O)₂NR'	i-Pr	Н	93
284	S(O)₂NR'	n-Bu	Н	
285	S(O)₂NR'	i-Bu	н	
286	S(O) <sub>2</sub> NR'	Allyl .	н	83
287	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH₂C≡CH	н	
288	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH=CH,	н	]
289	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	н	
290	S(O) <sub>2</sub> NR'	CF <sub>3</sub>	н	
291	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH₂CF₃	н	
292	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH₂CN	н	
293	S(O) <sub>2</sub> NR'	Cyclopropyl	н	
294	S(O)₂NR'	Cyclopropylmethyl	н	fest
295	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Н	
296	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Н	
297	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	н	
298	S(O)₂NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Н	
299	S(O)2NR'	2-Furanyl	Н	
300	S(O)2NR'	2-Pyrimidinyl	н	
301	S(O)2NR'	2-Oxazolyl	H	
302	S(O)2NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Н	
303	S(O)₂NR'	Tetrazolyl	н	
304	S(O)₂NR'	Н	Ме	
305	S(O)₂NR'	Me	Ме	
306	S(O)₂NR'	Et	Me	Öl
307	S(O)₂NR'	n-Pr	Ме	į
308	S(O)₂NR'	i-Pr	Ме	Öl
309	S(O)₂NR'	n-Bu	Me	
310	S(O)₂NR'	i-Bu	Ме	
311	S(O)₂NR'	Allyl	Me	
312	S(O)₂NR'	CH₂C≡CH	Me	94
313	S(O)₂NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Ме	
314	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Ме	
315	S(O)₂NR'	CF₃	Me	
316	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	}
317	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CN	Me	
318	S(O)₂NR'	Cyclopropyl	Me	
319	S(O)₂NR'	Cyclopropylmethyl	Me	
320	S(O)₂NR'	CH₂CO₂Me	Ме	
321	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Me	
322	S(O)₂NR'	CH₂-(N-morpholinyl)	Me	
323	S(O)₂NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Ме	
324	S(O)₂NR'	Furanyl	Me	
325	S(O)₂NR'	2-Pyrimidinyl	Me	
326	S(O)₂NR'	2-Oxazolyl	Ме	

Bsp. Nr.	Y	R	R'	m n [°C]
327	S(O) <sub>2</sub> NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Me	m.p. [°C]
328	S(O)2NR'	Tetrazolyl	Me	
329	S(O) <sub>2</sub> NR'	Н		
330	S(O) <sub>2</sub> NR'	Me	Et	
331	S(O) <sub>2</sub> NR'	Et	Et	
332	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Pr	Et	
333	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Pr	Et	
334	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Bu	Et	70
335	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Bu	Et	
336	S(O) <sub>2</sub> NR'	Aliyi	Et	<b>.</b> .
337	S(O) <sub>2</sub> NR'		Et	ÖI
338	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> C≡CH	Et	
339	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Et	]
340	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH₂CH₂F	Et	İ
341	S(O) <sub>2</sub> NR'	CF <sub>3</sub>	Et	Į j
342	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Et	[
343	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH₂CN	Et	
344		Cyclopropyl	Et	
345	S(O) <sub>2</sub> NR'	Cyclopropylmethyl	Et	
346	S(O)₂NR'   S(O)₂NR'	CH₂CO₂Me	Et	
347	1 ' '-	CH₂CH₂NMe₂	Et	
348	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Et	
349	S(O)₂NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Et	
350	S(O) <sub>2</sub> NR'	Furanyl	Et	
351	S(O)₂NR'	2-Pyrimidinyl	Et	
352	S(O)₂NR'	2-Oxazolyl	Et	
353	S(O)₂NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Et	,
	S(O)₂NR'	Tetrazolyl	Et	
354	S(O)₂NR'	n-Pr	n-Pr	ÖI
355	S(O)₂NR'	CH₂SCH₂CH₂	n-Pr	
356	S(O)₂NR'	CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂	n-Pr	152
357	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CH=CHCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	n-Pr	138
358 359	S	2-methylmercapto-1,3,4-thiad	iazol-5-yl	92
	3	5-(trifluormethyl)-pyridin-2-yl		78
360	S   S   S	3-(trifluormethyl)-pyridin-2-yl		68
361	3	4-methyl-thiazol-2-yl		Öl
362	S	3-(methylmercapto)-1,2,4-thiadi	azol-5-yl	Öl
363	-	4-Pyridinyl		88
364	18	2-Methyl-furan-3-yl		Öl
365	5	4-(trifluormethoxy)-phenyl		57
366	S S S S S S S S	2-Imidazolyl		171
367	5	5-Methyl-1,2,4-triazol-3-yl		95
368	8	2-Thiazolyl		Öl
369	8	Dimethylamino-thiocarbonyl		fest
370	8	4,6-Dimethyl-pyrimidin-2-yl		ÖI
371	S	5-Methyl-1,3,4-thiadiazol-2-yl		98
372	NR'C(S)NH	CO₂Et	Н	136

Bsp. Nr.	ΙΥ	R	R'	m.p. [°C]
373	NR'C(O)	CH(imidazolyl-)CF <sub>2</sub> C(O)		Öl
374	NR'C(O)	CH(Me)CH₂C(O)		Öl
375	NR'C(O)	CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(O)		Öl
376	NR'C(O)	CH(Me)CH(Me)C(O)		Öl
377	NR'C(O)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(O)		Öl
		CH(Me)CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(O)		Ö
378	NR'C(O)			Öl
379	NR'C(O)	CH <sub>2</sub> CH(Me)CH <sub>2</sub> C(O)		Ö
380	NR'C(O)	CH <sub>2</sub> CMe <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(O)		
381	NR'C(O)	CH <sub>2</sub> C[-(CH <sub>2</sub> ) <sub>4</sub> -]CH <sub>2</sub> C(O)		Öl
382	NR'C(O)	\$\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\\		192
383	NR'C(O)N(H)	CH(CHMe <sub>2</sub> )CO <sub>2</sub> Et	Н	Öi
	NR'C(S)N(H)	Et	H	Öi
384		CMe <sub>3</sub>	Н	113
385	NR'C(S)N(H)		H	ÖI
386	NR'C(S)N(H)	-p-Tol	[ ]	101
387	NR'C(O)	CF <sub>3</sub>	<b>H</b>	148
388	NR'C(O)N(H)	Et	Н	144
389	NR'C(O)N(H)	C(H)Me <sub>2</sub>	ļH	159
390	NR'C(O)N(H)	Bu	(H	117
391	NR'C(O)N(H)	(CH₂)₄Me	H	118
392	NR'C(O)N(H)	Cyclohexyl	H	160
393	NR'C(O)N(H)	C(H)MeCO₂Et	H	157
394	NR'C(O)N(H)	C(O)Ph	H	182
395	NR'C(O)N(H)	(4-CF <sub>3</sub> -Ph)	lн	170
396	NR'C(O)N(H)	$(2,6-C_6H_3F_2)$	H	193
397	NR'C(O)			ÖI
398	NR'C(O)	CH <sub>2</sub> C(H)PhCH <sub>2</sub> C(O)		ÖI
399	NR'C(O)	CMe=CMeC(O)		Öl
399	1411 0(0)			1
400	NIP'C(O)	/-\		ÖI
400	NR'C(O)			5'
		C(0)		
i		C(O)		

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
401	NR'C(O)N(H)	CMe <sub>3</sub>	Н	120
402	NR'C(O)O	CH₂C≘CH	Н	fest
403	NR'SO <sub>2</sub>	C(H)Me <sub>2</sub>	H	ÖI
404	NR'C(O)	CH₂OC(O)Me	Н	80
405	NR'C(O)	(CH <sub>2</sub> ) <sub>3</sub> Cì	H	56
406	NR'C(O)	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> SMe	Н	96
407	NR'C(O)O	Bu	Н	ÖI
408	NR'C(O)O	Cyclopentyl	Н	Öl
409	NR'C(O)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> C(O)	······································	87
410	NR'C(O)N(H)	Ph	Н	129
411	NR'H*HSO₄*	Н	Н	fest

Tabelle 3:

minnonin, 480 - 00001941 1 5

Bsp. Nr.	·	R	R'	m.p. [°C]
1	0	n-Pr		Öl
2		i-Pr		ÖI
3		n-Bu		
4	0	i-Bu		
5	0	Allyl		Öl
6	0	CH <sub>2</sub> C≡CH		Qi
7	0	CH=CH <sub>2</sub>		
8	0	CH₂CH₂F		
9	0	CF₃		
10	0	CH₂CF₃		
11	O .	CH₂CN		
12	0	Cyclopropyl		
13	0	Cyclopropylmethyl		
14	O ·	CH₂CO₂Me		
15	0	CH₂CH₂NMe₂		
16	0	CH₂-(N-morpholinyl)		
17	0	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
18	0	n-Hex		
19	0	2-Furanyl		
20	0	2-Pyrimidinyl		
21	0	2-Oxazolyl		
22	0	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		}
23	0	Tetrazolyl		
24	0	2-Hexahydropropanyl		
25	S	Н		
26	S	Et		ш.
27	<b> </b> S	i-Pr		Öl
28	S S S S S S S S S S S S S S S S S S S	n-Bu		
29	S	i-Bu		
30	S	Allyl		
31	S	CH <sub>2</sub> C≡CH		İ
32	\S	CH=CH₂		
33	S	CH₂CH₂F		
34	S	CF <sub>3</sub>		۱
35	S	CH₂CF₃		ÖI
36	S	CH₂CN		
37	S	Cyclopropyl		
38	s	Cyclopropylmethyl		<u> </u>

Bsp. Nr.	Y	R	R'	m.p. [°C]
39	S	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		m.p. [ C]
40	s	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
41	s	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
42	S			]
43	S	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl n-Hex		
44	S			
45	S	2-Furanyl		
	3	2-Pyrimidinyl		
46	s	2-Oxazolyl		
47	s	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
48		Tetrazolyl		
49	s	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		Öl
50	S(O)	Me		
51	S(O)	Et		ĺ
52	S(O)	n-Pr		
53	S(O)	i-Pr		İ
54	S(O)	n-Bu		
55	S(O)	i-Bu	(X)	1
56	S(O)	Allyl	×	l
57	S(O)	CH <sub>2</sub> C≡CH		į
58	S(O)	CH <sub>2</sub> C=CH		
59	S(O)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	·	Į
60	S(O)		1	ļ
61	S(O)	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	1	l
62	S(O)	CH <sub>2</sub> CN		Į
63	S(O)	Cyclopropyl		ļ
64	S(O)			
65	S(O)	Cyclopropylmethyl CH₂CO₂Me		1
66	S(O)			İ
67	S(O)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
68	S(O)	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
69	S(O)	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
70	S(O)	n-Hex		ļ
71	S(O) S(O)	2-Furanyl		Ì
72	S(O)	2-Pyrimidinyl		
73	S(O) S(O)	2-Oxazolyi		1
74		5-[1,2,4]-oxdiazolyl		j
	S(O)	Tetrazolyl		
75 76	S(O) <sub>2</sub>	Me		84
76 77	S(O) <sub>2</sub>	Et		į
77 79	S(O) <sub>2</sub>	n-Pr		1
78	S(O) <sub>2</sub>	i-Pr		
79	S(O) <sub>2</sub>	n-Bu		
80	S(O) <sub>2</sub>	i-Bu		
81	S(O) <sub>2</sub>	Allyl		

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
82	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> C≡CH		
83	S(O) <sub>2</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	·	
84	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		1
85	S(O) <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>		
86	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		
87	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CN		
88	S(O) <sub>2</sub>	Cyclopropyl		
	S(O) <sub>2</sub>	Cyclopropylmethyl		
89				
90	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		
91	S(O) <sub>2</sub>	CH₂CH₂NMe₂		
92	S(O) <sub>2</sub>	CH₂-(N-morpholinyl)		
93	S(O) <sub>2</sub>	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
94	S(O) <sub>2</sub>	n-Hex	ļ	
95	S(O) <sub>2</sub>	Furanyl		
96	S(O) <sub>2</sub>	2-Pyrimidinyl		
97	S(O) <sub>2</sub>	2-Oxazolyl		1
98	S(O) <sub>2</sub>	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
99	S(O) <sub>2</sub>	Tetrazolyl		
100	OC(O)	H		
101	oc(o)	Et		1
102	00(0)	n-Pr		
103	00(0)	i-Pr		
104	OC(O) .	n-Bu		
105	OC(O)	i-Bu	·	1
106	00(0)	Allyl		
107	OC(O)	CH₂C≡CH		
				1
108	00(0)	CH=CH <sub>2</sub>		
109	OC(O)	CH₂CH₂F		1
110	OC(O)	CF <sub>3</sub>		1 1
111	OC(O)	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		
112	OC(O)	CH₂CN		
113	OC(O)	Cyclopropyl		
114	OC(O)	Cyclopropylmethyl		ļ .
115	OC(O)	CH₂CO₂Me		
116	OC(O)	CH₂CH₂NMe₂		
117	OC(O)	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		1
118	OC(O)	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
119	oc(o)	n-Hex		
120	oc(o)	2-Furanyl		
121	OC(O)	2-Pyrimidinyl		
122	00(0)	2-Oxazolyl		1
123	OC(O)	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		İ
124	OC(O)	Tetrazolyl		
125	00(0)0	Me		
		Et	1	
126	00(0)0	n-Pr		
127	00(0)0	1		
128	00(0)0	i-Pr	, '	
129	00(0)0	n-Bu		
130	OC(O)O	i-Bu		

WO 00/35913 PCT/EP99/09684

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
131	OC(O)O	Allyl		
132	00(0)0	CH₂C≡CH		1
133	oc(o)o	CH=CH <sub>2</sub>		
134	00(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		
135	00(0)0	CF <sub>3</sub>	1	]
136	0C(0)0	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		ĺ
137	00(0)0	CH <sub>2</sub> CN		
138	00(0)0	Cyclopropyl		
139	00(0)0			
140	00(0)0	Cyclopropylmethyl		
141	00(0)0	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		
142	00(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
		CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
143	OC(O)O	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
144	OC(O)O	n-Hex		
145	OC(O)O	2-Furanyl		
146	OC(O)O	2-Pyrimidinyl		
147	OC(O)O	2-Oxazolyl		1
148	OC(O)O	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
149	OC(O)O	Tetrazolyl		
150	OC(O)NR'	Н	Н	
151	OC(O)NR'	Ме	Н	
152	OC(O)NR'	Et	Н	
154	OC(O)NR'	n-Pr	Н	
155	OC(O)NR'	i-Pr	H	
156	OC(O)NR'	n-Bu	Н	
157	OC(O)NR'	i-Bu	Н	
158	OC(O)NR'	Allyl	Н	
159	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> C≡CH	Н	
160	OC(O)NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Н	
161	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Н	
162	OC(O)NR'	CF <sub>3</sub>	Н	
163	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
164	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CN	Н	
165	OC(O)NR'	Cyclopropyl	Н	
166	OC(O)NR'	Cyclopropylmethyl	l H	
167	OC(O)NR'	CH₂CO₂Me	ГĤ	
168	OC(0)NR'		l'i	
169	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	H	
170	OC(O)NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	H H	
171	OC(O)NR'	n-Hex	In H	
172	OC(O)NR'	2-Furanyl	lu H	
173	OC(O)NR'		Į.	
174	1 ' '	2-Pyrimidinyl	H	
4	OC(O)NR'	2-Oxazolyl	H	
175 176	OC(O)NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	H	
	OC(O)NR'	Tetrazolyi	Н	
177	OC(O)NR'	Н	Ме	
178	OC(O)NR'	Me	Ме	
179	OC(O)NR'	Et_	Ме	1
180	OC(O)NR'	n-Pr	Ме	

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
181	OC(O)NR'	i-Pr	Ме	
182	OC(O)NR'	n-Bu	Me	1
183	OC(O)NR'	i-Bu	Ме	
184	OC(O)NR'	Allyl	Ме	
185	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> C≡CH	Ме	
186	OC(O)NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Me	1
187	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Me	
188	OC(O)NR'	CF <sub>3</sub>	Me	
189	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Ме	
190	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CN	Me	
	OC(O)NR'	Cyclopropyl ·	Ме	
191		•	Me	1
192	OC(O)NR'	Cyclopropylmethyl CH₂CO₂Me	Me	
193	OC(O)NR'		Me	1
194	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Me	
195	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Me	
196	OC(O)NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Me	
197	OC(O)NR'	n-Hex		
198	OC(O)NR'	2-Furanyl	Me	
199	OC(O)NR'	2-Pyrimidinyl	Me	
200	OC(O)NR'	2-Oxazolyl	Me	
201	OC(O)NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Me	
202	OC(O)NR'	Tetrazolyl	Ме	<u> </u>
203	OC(O)NR'	Н	Et	
204	OC(O)NR'	Me	Et	1
205	OC(O)NR'	Et	Et	
206	OC(O)NR'	n-Pr	Et	
207	OC(O)NR'	i-Pr	Et	
208	OC(O)NR'	n-Bu	Et	
209	OC(O)NR'	i-Bu	Et	
210	OC(O)NR'	Allyi	Et	
211	OC(O)NR'	CH,C≡CH	Et	
212	OC(O)NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Et	
213	OC(O)NR'	CH₂CH₂F	Et	
214	OC(O)NR'	CF <sub>3</sub>	Et	
215	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Et	
216	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CN	Et	
217	OC(O)NR'	Cyclopropyl	Et	
	OC(O)NR'	Cyclopropylmethyl	Et	}
218	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Et	
219		CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Et	
220	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Et	1
221	OC(O)NR'		1 <u>_</u> .	
222	OC(O)NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Et	
223	OC(O)NR'	n-Hex	Et	
224	OC(O)NR'	2-Furanyl	Et	1
225	OC(O)NR'	2-Pyrimidinyl	Et	1
226	OC(O)NR'	2-Oxazolyl	l l	1
227	OC(O)NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Et	1
228	OC(O)NR'	Tetrazolyl	Et	
229	OC(O)C(O)O	H		_l

WO 00/35913 PCT/EP99/09684

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
230	OC(O)C(O)O	Me		
231	OC(O)C(O)O	Et		
232	OC(O)C(O)O	n-Pr		
233	OC(O)C(O)O	i-Pr		
234	00(0)0(0)0	n-Bu		
235	0C(0)C(0)0	i-Bu		
236	00(0)0(0)0	Allyl		
237	0C(0)C(0)0	CH,C≡CH		
238	0C(0)C(0)0	CH=CH <sub>2</sub>		
239	0C(0)C(0)0	CH,CH,F		
240	00(0)0(0)0	CF <sub>3</sub>		
241	00(0)0(0)0	CH₂CF₃		
242	00(0)0(0)0	CH₂CN		
243	00(0)0(0)0	Cyclopropyl		
244	00(0)0(0)0	Cyclopropylmethyl		
245	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		
246	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
247	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		I
248	00(0)0(0)0	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
249	00(0)0(0)0	n-Hex		l
250	00(0)0(0)0	Furanyl		4
251	00,0000	2-Pyrimidinyl		
252	00(0)0(0)0	2-Oxazolyl		
253	00(0)0(0)0	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
254	00(0)0(0)0	Tetrazolyl		
255	S(O) <sub>2</sub> NR'	H	Н	
256	S(O) <sub>2</sub> NR'	Me	Н	
257	S(O) <sub>2</sub> NR'	Et	Н	
258	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Pr	Н	
259	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Pr	Н	
260	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Bu	Н	
261	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Bu	Н	
262	S(O) <sub>2</sub> NR'	Allyi	Н	
263	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH,C≡CH	Н	
264	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Н .	
265	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Н	
266	S(O) <sub>2</sub> NR'	CF <sub>3</sub>	Н	
267	S(O)₂NR'	CH₂CF₃	н	
268	S(O)₂NR'	CH₂CN	Н	
269	S(O) <sub>2</sub> NR'	Cyclopropyl	Н	
270	S(O)₂NR'	Cyclopropylmethyl	H	
271	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Н	
272	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Н	
273	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Н	
274	S(O)₂NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	H	
275	S(O)₂NR'	n-Hex	Н	]
276	S(O)2NR'	Furanyl	Н	
277	S(O)2NR'	2-Pyrimidinyl	Н	
278	S(O)₂NR'	2-Oxazolyl	Н	
	. /2	1 =	<u> </u>	<del></del>

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
279	S(O)₂NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
280	S(O)₂NR'	Tetrazolyl		
281	S(O) <sub>2</sub> NR'	Н	Ме	
282	S(O)₂NR'	Me	Me	
283	S(O) <sub>2</sub> NR'	Et	Ме	
284	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Pr	Me	
	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Pr	Me	İ
285	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Bu	Me	
286		i-Bu	Me	
287	S(O)₂NR'	3	Me	
288	S(O)₂NR'	Allyl	Me	
289	S(O)₂NR'	CH₂C≡CH	Me	
290	S(O)₂NR'	CH=CH <sub>2</sub>		
291	S(O)₂NR'	CH₂CH₂F	Me	
292	S(O)₂NR'	CF <sub>3</sub>	Me	
293	S(O)₂NR'	CH₂CF₃	Me	
294	S(O)₂NR'	CH₂CN	Me	
295	S(O)₂NR'	Cyclopropyl	Ме	
296	S(O)₂NR'	Cyclopropyimethyl	Ме	
297	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Ме	
298	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Ме	
299	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Ме	
300	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Me	
301	S(O)2NR'	n-Hex	Me	
302	S(O) <sub>2</sub> NR'	Furanyl	Me	
303	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Pyrimidinyl	Me	
304	S(O)₂NR'	2-Oxazolyl	Me	
305	S(O) <sub>2</sub> NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Me	
306	S(O) <sub>2</sub> NR'	Tetrazolyl	Ме	
		H	Et	
307	S(O)₂NR'	Me	Et	
308	S(O)₂NR'	Et	Et	
309	S(O)₂NR'		Et	
310	S(O)₂NR'	n-Pr	Et	
311	S(O)₂NR'	i-Pr		
312	S(O)₂NR'	n-Bu	Et	
313	S(O)₂NR'	i-Bu	Et	
314	S(O)₂NR'	Allyl	Et	
315	S(O)₂NR'	CH₂C≡CH	Et	
316	S(O)₂NR'	CH=CH₂	Et	
317	S(O)₂NR'	CH₂CH₂F	Et	
318	S(O)₂NR'	CF <sub>3</sub>	Et	
319	S(O)₂NR'	CH₂CF₃	Et	
320	S(O)2NR'	CH <sub>2</sub> CN	Et	
321	S(O)2NR'	Cyclopropyl	Et	
322	S(O) <sub>2</sub> NR'	Cyclopropylmethyl	Et	
323	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH₂CO₂Me	Et	
324	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Et	
325	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Et	
		2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	L	
326 327	S(O)₂NR' S(O)₂NR'	n-Hex	Et	

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
328	S(O) <sub>2</sub> NR'	Furanyl	Et	
329	S(O)₂NR'	n-Hex	Et	
330	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Pyrimidinyl	Et	
331	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Oxazolyl	Et	
332	S(O) <sub>2</sub> NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Et	
333	S(O)₂NR'	Tetrazolyl	Et	

Tabelle 4:

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
1	0	Н		}
	0	Me		
2	0	Et	1	Öl
4	0	n-Pr	1	
5	0	i-Pr		
6	0	n-Bu		
7	0	i-Bu		
8	0	Allyl	ļ	i i
9	0	CH₂C≡CH		
10	0	CH=CH <sub>2</sub>	i	
111	0	CH₂CH₂F		l l
12	0	CF <sub>3</sub>		
13	0	CH₂CF₃		i
14	0	CH₂CN		
15	0	Cyclopropyl		
16	0	Cyclopropylmethyl		
17	0	CH₂CO₂Me	1	
18	0	CH₂CH₂NMe₂		
19	0	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
20	0	2-Chlor-pyridin-5-yl-methy	/	l l
21	0	n-Hex		
22	0	2-Furanyl		<b>\</b>
23	0	2-Pyrimidinyl		
24	0	2-Oxazolyl		
25	0	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
26	0	Tetrazolyl		
27	S	Н		
28	S	Me	1	
29	S S	Et		
30	S	n-Pr	1	
31	S	i-Pr		ì
32	s	n-Bu		
33	S	i-Bu		
34	S	Allyl	1	
35	s	CH₂C≡CH		
36	s	CH=CH₂		
37	s	CH₂CH₂F		
38	s _	CF <sub>3</sub>		

Bsp. Nr.	Ý	R	R'	m.p. [°C]
39	S	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		
40	s	CH₂CN		
41	s	Cyclopropyl		
42	S	Cyclopropylmethyl		
43	S	CH₂CO₂Me		
44	S	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
45	S	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
46	s	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
47	<i>S S S S S S S S S S</i>	n-Hex		
48	S	2-Furanyl		
49	S	2-Pyrimidinyl		
50	S	2-Oxazolyl		
51	S	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
52	S	Tetrazolyi		
53	S(O)	H		
54	S(O)	Me		
55	S(O)	Et		
56	S(O)	n-Pr		
57	S(O) .	i-Pr		
58	S(O)	n-Bu		
59	S(O)	i-Bu		
60	S(O)	Allyl		
61	S(O)	CH <sub>2</sub> C≡CH		
62	S(O)	CH <sub>2</sub> C=CH CH=CH <sub>2</sub>		
63	S(O)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		
64	S(O)			
65	S(O)	CF <sub>3</sub>		
66	S(O)	CH₂CF₃ CH₂CN	ļ	
67	S(O)	Cyclopropyl		
68	S(O)	Cyclopropylmethyl	ł	
69	S(O)	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		
70	S(O)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
71	S(O)	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	1	
72	S(O)	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
73	S(O)	n-Hex		
74	S(O)	2-Furanyl		
75	S(O)	2-Pyrimidinyl		
76	S(O)	2-Oxazolyl		
77	S(O)	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Ì	
78	S(O)	Tetrazolyl		
79	S(O) <sub>2</sub>	n-Hex		
80	S(O) <sub>2</sub>	Me		
81	S(O) <sub>2</sub>	Et		
82	S(O) <sub>2</sub>	n-Pr		
83	S(O) <sub>2</sub>	i-Pr	1	
84	S(O) <sub>2</sub>	n-Bu	1	
85	S(O) <sub>2</sub>	i-Bu	1	[
86	S(O) <sub>2</sub>	Allyl		
87	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> C≡CH		[
L07	10(0/2	UU12C≡CU	<u> </u>	<u> </u>

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
88	S(O) <sub>2</sub>	CH=CH <sub>2</sub>		
89	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		
90	S(O) <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>		
i		CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		
91	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CN		
92	S(O) <sub>2</sub>			
93	S(O) <sub>2</sub>	Cyclopropyl		
94	S(O) <sub>2</sub>	Cyclopropylmethyl		
95	S(O) <sub>2</sub>	CH₂CO₂Me		
96	S(O) <sub>2</sub>	CH₂CH₂NMe₂		
97	S(O) <sub>2</sub>	CH₂-(N-morpholinyl)		
98	S(O) <sub>2</sub>	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		]
99	S(O) <sub>2</sub>	n-Hex		
100	S(O) <sub>2</sub>	2-Furanyl		
101	S(O) <sub>2</sub>	2-Pyrimidinyl		
102	S(O) <sub>2</sub>	2-Oxazolyl		
103	S(O) <sub>2</sub>	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
1				
104	S(O) <sub>2</sub>	Tetrazolyl		
105	OC(O)	H		]
106	OC(O)	Me		
107	OC(O)	Et		
108	OC(O)	n-Pr		
109	OC(O)	i-Pr		
110	OC(O)	n-Bu	·	•
111	OC(O)	i-Bu		
112	OC(O)	Allyl	Ì	
113	oc(o)	CH₂C≡CH		
114	oc(o)	CH=CH <sub>2</sub>		
115	00(0)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		· l
116	OC(O)	CF <sub>3</sub>	1	
117	00(0)	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		
118	OC(O)	CH <sub>2</sub> CN		
119	OC(O)	Cyclopropyl		]
120	OC(O)	Cyclopropylmethyl		1
121	OC(O)	CH₂CO₂Me		
122	OC(O)	CH₂CH₂NMe₂		
123	OC(O)	CH₂-(N-morpholinyl)		
124	OC(O)	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		Į (
125	OC(O)	n-Hex		
126	OC(O)	2-Furanyl	1	
127	loc(o)	2-Pyrimidinyl		
128	loc(o)	2-Oxazolyl		
129	00(0)	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
130	OC(O)	Tetrazolyl		
131	00(0)0	n-Hex		
132	00(0)0	Me	1	1
133		Et		
	00(0)0	n-Pr		
134	00(0)0	•		
135	00(0)0	i-Pr		1
136	OC(O)O	n-Bu	<u> </u>	1

Bsp. Nr.	Y	R	R'	m.p. [°C]
137	OC(O)O	i-Bu		
138	00(0)0	Aliyi		
139	00(0)0	CH₂C≡CH		
140	00(0)0	CH=CH <sub>2</sub>		
141	00(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		
142	00(0)0	CF <sub>3</sub>		
143	00(0)0	CH₂CF₃		
144	00(0)0	CH <sub>2</sub> CN		
145	00(0)0	Cyclopropyl		
146	00(0)0	Cyclopropylmethyl		
147	00(0)0	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		
148	00(0)0			
149	00(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
150		CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
	00(0)0	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
151	00(0)0	n-Hex		
152	00(0)0	2-Furanyl		
153	00(0)0	2-Pyrimidinyl		
154	00(0)0	2-Oxazolyl		
155	00(0)0	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
156	00(0)0	Tetrazolyl		
157	OC(O)NR'	Н	Н	
158	OC(O)NR'	Me	Н	
159	OC(O)NR'	Et	Н	
160	OC(0)NR'	n-Pr	H	0.
161	OC(O)NR'	i-Pr	Н	*
162	OC(O)NR'	n-Bu	Н	
163	OC(0)NR'	i-Bu	H	
164	OC(O)NR'	Allyl	Н	
165	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> C≡CH	Н	
166	OC(O)NR'	CH=CH₂	H	
167	OC(O)NR'	CH₂CH₂F	H	
168	OC(O)NR'	CF <sub>3</sub>	H	
169	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	
170	OC(O)NR'	CH₂CN	H	
171	OC(O)NR'	Cyclopropyl	Н	
172	OC(O)NR'	Cyclopropylmethyl	Н	
173	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Н	
174	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	H	
175	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Н	
176	OC(O)NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Н	
177	OC(0)NR'	n-Hex	Н	
178	OC(0)NR'	2-Furanyl	H	
179	OC(0)NR'	2-Pyrimidinyl	Н	
180	OC(O)NR'	2-Oxazolyl	H	
181	OC(0)NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	H	
182	OC(O)NR'	Tetrazolyl	l H	
183	OC(O)NR'	H	Me	
184	OC(O)NR'	Me	Me	
185	OC(O)NR'	1		
103	100(U)INK	Et	Me	<u> </u>

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
186	OC(O)NR'	n-Pr	Me	
187	OC(O)NR'	i-Pr	Me	
188	OC(O)NR'	n-Bu	Me	
189	OC(0)NR'	i-Bu	Me	
190	OC(O)NR'	Allyl	Ме	
191	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> C≡CH	Me	
192	OC(O)NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Me	
193	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Me	
194	OC(0)NR'	CF <sub>3</sub>	Ме	
195	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
196	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CN	Me	
197	OC(O)NR'	Cyclopropyl	Me	
198	OC(O)NR'		Me	
199	OC(O)NR'	Cyclopropylmethyl	Me	
		CH₂CO₂Me	Me	
200	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
201	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Me	
202	OC(O)NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Me	
203	OC(O)NR'	n-Hex	Ме	
204	OC(O)NR'	2-Furanyl	Me	
205	OC(O)NR'	2-Pyrimidinyl	Ме	
206	OC(O)NR'	2-Oxazolyl	Ме	
207	OC(O)NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Ме	
208	OC(O)NR'	Tetrazolyl	Ме	·
209	OC(O)NR'	H	Et	
210	OC(O)NR'	Me	Et	
211	OC(O)NR'	Et	Et	
212	OC(O)NR'	n-Pr	Et	
213	OC(O)NR'	i-Pr	Et	
214	OC(O)NR'	n-Bu	Et	
215	OC(O)NR'	i-Bu	Et	
216	OC(O)NR'	Allyl	Et	[
217	OC(O)NR'	CH₂C≡CH	Et	
218	OC(O)NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Et	
219	OC(O)NR'	CH₂CH₂F	Et	
220	OC(O)NR'	CF <sub>3</sub>	Et	
221	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Et	
222	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CN	Et	
223	OC(O)NR'	Cyclopropyl	Et	
224	OC(O)NR'	Cyclopropylmethyl	Et	
225	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Et	
226	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> IVIE CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Et	1
227	OC(O)NR'	,	Et	
228	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Et	
229	OC(O)NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Et	
		2-Furanyl	Et	
230	OC(O)NR'	2-Pyrimidinyl	1	
231	OC(O)NR'	2-Oxazolyl	Et	
232	OC(O)NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Et	
234	OC(O)NR'	Tetrazolyl	Et	1
235	OC(O)NR'	n-Hex	Et	

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
236	OC(0)C(0)0	Cyclobutyl		· · · · ·
237	00(0)0(0)0	Me	į	
238	0000000	Et		
239	0000000	n-Pr		
240	00(0)0(0)0	i-Pr		
241	00(0)0(0)0	n-Bu		
242	00(0)0(0)0	i-Bu		
243	00(0)0(0)0	Allyl		
244	00(0)0(0)0	CH₂C≡CH		
245	0C(0)C(0)0	CH=CH <sub>2</sub>		
246	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		
247	0C(0)C(0)0	CF <sub>3</sub>		
248	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		
249	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> CN		
250	00(0)0(0)0	Cyclopropyl		1
251	00(0)0(0)0	Cyclopropylmethyl		
252	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		
253	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
254	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		Ì
255	00(0)0(0)0	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
256	00(0)0(0)0	n-Hex		į
257	00(0)0(0)0	Furanyl		
258	00(0)0(0)0	2-Pyrimidinyl		
259	00(0)0(0)0	2-Oxazolyl		
260	00(0)0(0)0	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
261	00(0)0(0)0	Tetrazolyl	:	
262	S(O)2NR'	Н	H	
263	S(O) <sub>2</sub> NR'	Me	Н	
264	S(O)₂NR'	Et	н	
265	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Pr	H	
266	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Pr	Н	
267	S(O)2NR'	n-Bu	H	
268	S(O)₂NR'	i-Bu	Н	
269	S(O)2NR'	Allyl	Н	
270	S(O)₂NR'	CH₂C≡CH	H	
271	S(O)₂NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Н	
272	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH₂CH₂F	Н	
273	S(O) <sub>2</sub> NR'	CF <sub>3</sub>	Н	
274	S(O)₂NR'	CH₂CF₃	Н	
275	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH₂CN	Н	
276	S(O) <sub>2</sub> NR'	Cyclopropyl	H	
277	S(O)₂NR'	Cyclopropylmethyl	н	
278	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	H	
279	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Н	
280	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Н	
281	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Н	
282	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Hex	Н	
283	S(O)₂NR'	2-Furanyl	Н	
284	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Pyrimidinyl	lн	

Bsp. Nr.	Y	R	R'	m.p. [°C]
285	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Oxazolyl	Н	
286	S(O)₂NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Н	
287	S(O)₂NR'	Tetrazolyl	Н	
288	S(O) <sub>2</sub> NR'	Н	Ме	
289	S(O)₂NR'	Me	Me	
290	S(O)₂NR'	Et	Ме	
300	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Pr	Me	
301	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Pr	Me	
302	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Bu	Ме	1
303	S(O)₂NR'	i-Bu	Ме	
304	S(O) <sub>2</sub> NR'	Allyl	Me	
305	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH,C≡CH	Me	
306	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Me	1
307	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Me	
308	S(O) <sub>2</sub> NR'	CF <sub>3</sub>	Me	
309	S(O) <sub>2</sub> NR'	_	Me	1
		CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
310	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CN	Me	
311	S(O)₂NR'	Cyclopropyl	Me	
312	S(O)₂NR'	Cyclopropylmethyl	Me	
313	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Me	1
314	S(O)₂NR'-	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Me	
315	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Me	
316	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Me	
317	S(O)₂NR'	n-Hex	Me	1
318	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Furanyl	Me	
319	S(O)₂NR'	2-Pyrimidinyl	Me	
320	S(O)₂NR'	2-Oxazolyi	Me	
321	S(O)₂NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Me	
322	S(O) <sub>2</sub> NR'	Tetrazolyl	Et	
323	S(O)₂NR'	H	Et	
324	S(O)₂NR'	Me Et	Et	
325	S(O)₂NR'	1	Et	
326	S(O)₂NR'	n-Pr i-Pr	Et	
327	S(O)₂NR'	1	Et	
328	S(O)₂NR'	n-Bu	1	[
329	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Bu	Et	
330	S(O)₂NR'	Allyl	Et	
331	S(O)₂NR'	CH₂C≡CH	1	
332	S(O)₂NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Et	
333	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Et	
334	S(O)₂NR'	CF <sub>3</sub>	Et	
335	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Et	
336	S(O)₂NR'	CH₂CN	Et	
337	S(O)₂NR'	Cyclopropyl	Et	
338	S(O)₂NR'	Cyclopropylmethyl	Et	
339	S(O)₂NR'	CH₂CO₂Me	Et	
340	S(O)₂NR'	CH₂CH₂NMe₂	Et	
341	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Et	
342	S(O)₂NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methy	Et	

Bsp. Nr.	Y	R	R'	m.p. [°C]
344	S(O)₂NR'	n-Hex	Et	
345	S(O)₂NR'	2-Furanyl	Et	
346	S(O)₂NR'	2-Pyrimidinyl	Et	
347	S(O)₂NR'	2-Oxazolyl	Et	
348	S(O)₂NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Et	
349	S(O)₂NR'	Tetrazolyl	Et	

Tabelle 5:

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C].
1	0	H		
2	0	Me		
3	0	Et		
4	0	n-Pr		
5	0	i-Pr	!	
6	0	n-Bu		
7	0	i-Bu		
8	0	Ailyl		
9	0	CH₂C≡CH		ł
10	0	CH=CH <sub>2</sub>		
111	0	CH₂CH₂F		
12	0	CF <sub>3</sub>		
13	o	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		
14	0	CH₂CN		
15	lo	Cyclopropyl	İ	
16	0	Cyclopropylmethyl		İ
17	O	CH₂CO₂Me		
18	O	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
19	0	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		1
20	O	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
21	0	n-Hex	!	}
22	0	2-Furanyl		1
23	lo	2-Pyrimidinyl		
24	0	2-Oxazolyl		
25	lo	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
26	0	Tetrazolyl		
27	S	Н		
28	999999999	Me	ł	
29	s	Et	1	
30	s	n-Pr		
31	S	i-Pr	<b>,</b>	
32	s	n-Bu		1
33	s	i-Bu		
33	ls	Allyl		
34	ls	CH <sub>2</sub> C≡CH		
35	s	Tetrazolyl		
36	s	CH=CH <sub>2</sub>		
37	S S S S	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		1
38	s	CF <sub>3</sub>	1	
30	19	OF 3	<u> </u>	<del></del>

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C].
39	S	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		
40	S	CH <sub>2</sub> CN		
41	S	Cyclopropyl		
42	S	Cyclopropylmethyl		
43	S	CH₂CO₂Me		
44	S	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
45	S	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		1
46	S	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
47	S	n-Hex		
48	S	2-Furanyl		
49	S	2-Pyrimidinyl		
50	S	2-Oxazolyl		
51	S	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
51a	S	Tetrazolyl		
52	S(O)	Cyclobutyl		
53	S(O)	Me		
54	S(O)	Et		
55	S(O)	n-Pr		}
56	S(O)	i-Pr		
57		n-Bu		
58	S(O)	i-Bu		
59	S(O)			
	S(O)	Allyl		i i
60	S(O)	CH <sub>2</sub> C≡CH		
61	S(O)	CH=CH <sub>2</sub>		
62	S(O)	CH₂CH₂F		
63	S(O)	CF <sub>3</sub>		
64	S(O)	CH₂CF₃		
65	S(O)	CH₂CN		
66	S(O)	Cyclopropyl		
67	S(O)	Cyclopropylmethyl		
68	S(O)	CH₂CO₂Me		
69	S(O)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
70	S(O)	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
71	S(O)	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
72	S(O)	n-Hex		
73	S(O)	2-Furanyl		
74	S(O)	2-Pyrimidinyl		
75 76	S(O)	2-Oxazolyl	ł	
76 77	S(O)	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
77	S(O)	Tetrazolyl		
78	S(O) <sub>2</sub>	Cyclobutyl		
79	S(O) <sub>2</sub>	Me		
80	S(O) <sub>2</sub>	Et_	1	
81	S(O) <sub>2</sub>	n-Pr	1	
82	S(O) <sub>2</sub>	i-Pr		
83	S(O) <sub>2</sub>	n-Bu		
84	S(O) <sub>2</sub>	i-Bu		
85	S(O) <sub>2</sub>	Allyl		
86	S(O) <sub>2</sub>	CH₂C≡CH		

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C].
87	S(O) <sub>2</sub>	CH=CH₂		
88	S(O) <sub>2</sub>	CH₂CH₂F		
89	S(O) <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>		
90	S(O) <sub>2</sub>	CH₂CF₃		
91	S(O) <sub>2</sub>	CH₂CN		
92	S(O) <sub>2</sub>	Cyclopropyl		
93	S(O) <sub>2</sub>	Cyclopropylmethyl		
94	S(O) <sub>2</sub>	CH₂CO₂Me		
95	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
96	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
97		2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
1	S(O) <sub>2</sub>	n-Hex	1	
98	S(O) <sub>2</sub>			ļ
99	S(O) <sub>2</sub>	2-Furanyl		
100	S(O) <sub>2</sub>	2-Pyrimidinyl		
101	S(O) <sub>2</sub>	2-Oxazolyl		
102	S(O) <sub>2</sub>	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
103	S(O) <sub>2</sub>	Tetrazolyl		
104	OC(O)	Н		
105	OC(O)	Ме		
106	OC(O)	Et		1
107	OC(O)	n-Pr		
108	OC(O)	i-Pr		1
109	OC(O)	n-Bu		
110	00(0)	i-Bu		
111	00(0)	Allyl		
112	00(0)	CH <sub>2</sub> C≡CH		1
113	00(0)	CH=CH <sub>2</sub>		
114	00(0)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	1	
115	00(0)	CF <sub>3</sub>		
116	00(0)	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		]
117	00(0)	CH <sub>2</sub> CN		
118	OC(O)	Cyclopropyl		
119	00(0)	Cyclopropylmethyl		1
120	OC(O)	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		1
121	OC(O)	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> IVIe CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
1.00		1		
122	OC(O)	CH₂-(N-morpholinyl)		
1		2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	}	
124	OC(O)	n-Hex		
125	OC(O)	2-Furanyl	1	1
126	OC(O)	2-Pyrimidinyl		
127	OC(O)	2-Oxazolyl		{
128	OC(O)	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	1	
129	OC(O)	Tetrazolyl		
130	00(0)0	Cyclobutyl		
131	OC(O)O	Me .		
132	OC(O)O	Et	}	
133	OC(O)O	n-Pr		
134	00(0)0	i-Pr		1
135	00(0)0	n-Bu		l

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C].
136	OC(O)O	i-Bu		
137	00(0)0	Allyl		1
138	00(0)0	CH <sub>2</sub> C≡CH		
139	00(0)0	CH=CH <sub>2</sub>	İ	
140	00(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		
141	00(0)0	CF <sub>3</sub>	<u> </u>	
142	00(0)0	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		
143	00(0)0	CH <sub>2</sub> CN		ŀ
144	00(0)0	Cyclopropyl		
145	00(0)0	Cyclopropylmethyl		
146	00(0)0	CH₂CO₂Me		
147	00(0)0			i
148	00(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
		CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
149	00(0)0	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
150	00(0)0	n-Hex		
151	0C(0)0	2-Furanyl		
152	00(0)0	2-Pyrimidinyl		[
153	00(0)0	2-Oxazolyl		İ
154	OC(O)O	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		Ì
155	OC(O)O	Tetrazolyl		
156	OC(O)NR'	H	H	1
157	OC(O)NR'	Me	H .	ļ .
158	OC(O)NR'	Et	H	
159	OC(O)NR'	n-Pr	H	•
160	OC(O)NR'	i-Pr	Н	
161	OC(O)NR'	n-Bu	H	
162	OC(O)NR'	i-Bu	Н	.
163	OC(O)NR'	Allyl	Н	
164	OC(O)NR'	CH,C≡CH	H	
165	OC(O)NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Н	
166	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Н	
167	OC(O)NR'	CF <sub>3</sub>	Н	
168	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Н	
169	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CN	Н	
170	OC(O)NR'	Cyclopropyl	Н	
171	OC(O)NR'	Cyclopropylmethyl	Н	· ·
172	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Н	
173	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Н	
174	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Н	1
175	OC(O)NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Н	
176	OC(O)NR'	n-Hex	H	
177	OC(O)NR'	2-Furanyl	H	
178	OC(O)NR'	•	H	1
		2-Pyrimidinyl	H	
179	OC(O)NR'	2-Oxazolyl	1	
180 181	OC(O)NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	H	
	OC(O)NR'	Tetrazolyl		
182	OC(O)NR'	H	Me	1
183	OC(O)NR'	Me	Me	
184	OC(O)NR'	Et	Me	

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C].
185	OC(O)NR'	n-Pr	Me	
186	OC(O)NR'	i-Pr	Me	
187	OC(O)NR'	n-Bu	Me	
188	OC(O)NR'	i-Bu	Me	
189	OC(O)NR'	Allyi	Me	İ
190	OC(O)NR'	CH₂C≡CH	Ме	
200	OC(O)NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Me	
201	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Me	
202	OC(O)NR'	CF <sub>3</sub>	Me	
203	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
204	OC(0)NR'	CH <sub>2</sub> CN	Me	-
205	OC(0)NR'	Cyclopropyl	Me	
206	OC(O)NR'	Cyclopropylmethyl	Me	
207	OC(0)NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Me	
208	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Me	
209	OC(0)NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Me	
210	OC(O)NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Me	
210	OC(O)NR'	n-Hex	Me	
1			Me	
212	OC(0)NR'	2-Furanyl	Me	
213	. ,	2-Pyrimidinyl	Me	
214	OC(O)NR'	2-Oxazolyl	Me	
215	OC(O)NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Me	
216	OC(O)NR'	Tetrazolyl		
217	OC(O)NR'	<u>  H</u>	Et	ł l
218	OC(O)NR'	Me	Et	1
219	OC(O)NR'	Et_	Et	
220	OC(O)NR'	n-Pr	Et	i
221	OC(O)NR'	i-Pr	Et	
222	OC(O)NR'	n-Bu	Et	
223	OC(O)NR'	i-Bu	Et	
224	OC(O)NR'	Allyl	Et	
225	OC(O)NR'	CH₂C≡CH	Et	
226	OC(O)NR'	CH=CH₂	Et	]
227	OC(O)NR'	CH₂CH₂F	Et	
228	OC(O)NR'	CF <sub>3</sub>	Et	
229	OC(O)NR'	CH₂CF <sub>3</sub>	Et	}
230	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CN	Et	
231	OC(O)NR'	Cyclopropyl	Et	
232	OC(O)NR'	Cyclopropylmethyl	Et	
233	OC(O)NR'	CH₂CO₂Me	Et	
234	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Et	
235	OC(O)NR'	CH₂-(N-morpholinyl)	Et	
236	OC(O)NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Et	
237	OC(O)NR'	n-Hex	Et	
238	OC(O)NR'	2-Furanyl	Et	1
239	OC(O)NR'	2-Pyrimidinyl	Et	1
240	OC(O)NR'	2-Oxazolyl	Et	1
241	OC(O)NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Et	
242	OC(O)NR'	Tetrazolyl	Et	4

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C].
243	OC(O)C(O)O	cyclobutyl		
244	00(0)0(0)0	Me		
245	00(0)0(0)0	Et		
246	00(0)0(0)0	n-Pr		1
247	00(0)0(0)0	i-Pr		1
248	00(0)0(0)0	n-Bu		ļ
249	00(0)0(0)0	i-Bu		
250	00(0)0(0)0	Aliyi		į
251	00(0)0(0)0	CH₂C≡CH		
252	00(0)0(0)0	CH=CH <sub>2</sub>		1
253	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		
254	0C(0)C(0)0	CF <sub>3</sub>		İ
255	0C(0)C(0)0	CH₂CF₃		
256	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> CN		
257	0C(0)C(0)0	Cyclopropyl		
258	00(0)0(0)0	Cyclopropylmethyl		
259	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		
260	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
261	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
262	0C(0)C(0)0	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
263	00(0)0(0)0	n-Hex	İ	[
264	0C(0)C(0)0	2-Furanyl		
265	0C(0)C(0)0	2-Pyrimidinyl		
266	00(0)0(0)0	2-Oxazolyi		
267	0C(0)C(0)0	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		]
268	0C(0)C(0)0	Tetrazolyl		
269	S(O) <sub>2</sub> NR'	Н	Ме	
270	S(O)₂NR'	Me	Me	
271	S(O) <sub>2</sub> NR'	Et	Me	
272	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Pr	Me	
273	S(O)₂NR'	i-Pr	Me	
274	S(O)₂NR'	n-Bu	Me	
275	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Bu	Ме	
276	S(O) <sub>2</sub> NR'	Allyl	Me	1
277	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH₂C≡CH	Ме	
278	S(O)₂NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Ме	}
279	S(O)₂NR'	CH₂CH₂F	Me	
280	S(O) <sub>2</sub> NR'	CF <sub>3</sub>	Me	
281	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	
282	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH₂CN	Ме	
283	S(O) <sub>2</sub> NR'	Cyclopropyl	Me	
284	S(O)₂NR'	Cyclopropylmethyl	Me	
285	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Me	
286	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Me	
287	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Ме	
288	S(O)₂NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Ме	
289	S(O)₂NR'	n-Hex	Me	1
290	S(O)₂NR'	2-Furanyl	Me	
291	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Pyrimidinyl	Me	
	10(0/2.4.4	12 i yililidiriyi		ــــــــــــــــــــــــــــــــــــــ

Bsp. Nr.	Y	R	R'	m.p. [°C].
292	S(O)₂NR'	2-Oxazolyl	Ме	
293	S(O)₂NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Me	
294	S(O)₂NR'	Tetrazolyl	Ме	
295	S(O)₂NR'	Н	Et	
296	S(O)₂NR'	Me	Et	
297	S(O)₂NR'	Et	Et	
298	S(O)₂NR'	n-Pr	Et	
299	S(O)₂NR'	i-Pr	Et	
300	S(O)₂NR'	n-Bu	Et	
301	S(O)₂NR'	i-Bu	Et	
302	S(O)₂NR'	Allyl	Et	
303	S(O)₂NR'	CH₂C≡CH	Et	
304	S(O)₂NR'	CH=CH₂	Et	6
305	S(O)₂NR'	CH₂CH₂F	Et	
306	S(O)₂NR'	CF <sub>3</sub>	Et	
307	S(O)₂NR'	CH₂CF₃	Et	
308	S(O)₂NR'	CH₂CN	Et	
309	S(O)₂NR'	Cyclopropyl	Et	
310	S(O)₂NR'	Cyclopropylmethyl	Et	
311	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Et	
312	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Et	
313	S(O)₂NR'	CH₂-(N-morpholinyl)	Et .	
314	S(O)₂NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Et	
315	S(O)₂NR'	n-Hex	Et	,
316	S(O)₂NR'	2-Furanyl	Et	
317	S(O)₂NR'	2-Pyrimidinyl	Et	
318	S(O)₂NR'	2-Oxazolyl	Et	
319	S(O)₂NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Et	
320	S(O)₂NR'	Tetrazolyl	Et	

Tabelle 6:

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
1	0	Н .		
2	0	Me		
2 3	0	Et		
4 5	0	n-Pr		
5	0	i-Pr		
6	0	n-Bu		
6	0	i-Bu		
8	0	Allyl		
9	0	CH <sub>2</sub> C≡CH		
10	0	CH=CH <sub>2</sub>		
11	0	CH₂CH₂F		
12	0	CF <sub>3</sub>		
13	0	CH₂CF₃		
14	0	CH₂CN		
15	0	Cyclopropyl		
16	O. O	Cyclopropylmethyl		·
17	0	CH₂CO₂Me		
18	0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
19	0	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
20	0	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
21	0	2-Furanyl		}
22	0	2-Pyrimidinyl		
23	0	2-Oxazolyi		İ
24	0	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
25	0	Tetrazolyl	Į	
26	S	Н		
27	s	Ме		
28	s	Et		
29	S S S	n-Pr		
30	S S	i-Pr	1	
31	S	n-Bu		İ
32	s s s	i-Bu		
33	S	Allyl		
34	S	CH₂C≡CH	1	
35	s	CH=CH <sub>2</sub>	<u> </u>	
36	S	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		
37	s	CF <sub>3</sub>	1	
38	S S	CH₂CF₃		
39	s	CH <sub>2</sub> CN		

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
40	S	Cyclopropyl		
41	S	Cyclopropylmethyl		
42	S	CH₂CO₂Me		
43	9	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
44	0	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		1
	S	_ ` ` .		1
45	S S S S S S S S S S S S	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
46	S	2-Furanyl		
47	S	2-Pyrimidinyl		
48	S	2-Oxazolyl		
49	S	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		]
50	S	Tetrazolyl		
51	S(O)	n-Hex		
52	S(O)	Me		
53	s(o)	Et		
54	S(O)	n-Pr		
55	S(O)	i-Pr	1	
56	S(O)	n-Bu		1
		i-Bu	1	
57	S(O)			
58	S(O) .	Allyl		
59	S(O)	CH₂C≡CH		
60	S(O)	CH=CH₂		
61	S(O)	CH₂CH₂F		
62	S(O)	CF₃		
63	S(O)	CH₂CF₃		
64	S(O)	CH₂CN		
65	S(O)	Cyclopropyl		
66	S(O)	Cyclopropylmethyl	Į	
67	S(O)	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		
68	S(O)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Ì	
				1
69	S(O)	CH₂-(N-morpholinyl)		
70	S(O)	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		1
71	S(O)	2-Furanyl	1	
72	S(O)	2-Pyrimidinyl	1	
73	S(O)	2-Oxazolyi		
74	S(O)	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	1	
75	S(O)	Tetrazolyl		<b>\</b>
76	S(O) <sub>2</sub>	n-Hex		
77	S(O) <sub>2</sub>	Me		
78	S(O) <sub>2</sub>	Et		
79	S(O) <sub>2</sub>	n-Pr	1	
80	S(O) <sub>2</sub>	i-Pr		}
81		n-Bu		
	S(O) <sub>2</sub>	•	1	
82	S(O) <sub>2</sub>	i-Bu	1	
83	S(O) <sub>2</sub>	Allyl	1	
84	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> C≡CH	1	1
85	S(O) <sub>2</sub>	CH=CH₂		
86	S(O) <sub>2</sub>	CH₂CH₂F	1	1
87	S(O) <sub>2</sub>	CF₃	-	
88	S(O)₂	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
89	S(O) <sub>2</sub>	CH₂CN		
90	S(O) <sub>2</sub>	Cyclopropyl		
91	S(O) <sub>2</sub>	Cyclopropylmethyl		1
92	S(O) <sub>2</sub>	CH₂CO₂Me	i	}
93	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	l	
94	S(O) <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
95	S(O) <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub>	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		1
96	S(O) <sub>2</sub>	2-Furanyl		1
97	S(O) <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub>	2-Pyrimidinyl		[
98	S(O) <sub>2</sub> S(O) <sub>2</sub>	2-Oxazolyl		
		5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
99	S(O) <sub>2</sub>			
100	S(O) <sub>2</sub>	Tetrazolyl		
101	00(0)	H		
102	OC(O)	Me		
103	OC(O)	Et		
104	OC(O)	n-Pr		
105	OC(O)	i-Pr		
106	OC(O)	n-Bu		
107	OC(O)	i-Bu		
108	OC(O)	Allyl		
109	OC(O)	CH₂C≡CH		
110	OC(O)	CH=CH₂		
1111	OC(O)	CH₂CH₂F		
112	OC(O)	CF₃	·	
113	OC(O)	CH₂CF₃		
114	OC(O)	CH₂CN		
115	OC(O)	Cyclopropyl		
116	OC(O)	Cyclopropylmethyl		
117	OC(O)	CH₂CO₂Me		
118	OC(O)	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
119	OC(O)	CH₂-(N-morpholinyl)		
120	OC(O)	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
121	OC(O)	2-Furanyl		
122	OC(O)	2-Pyrimidinyl		
123	OC(O)	2-Oxazolyl		
124	OC(O)	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
125	OC(O)	Tetrazolyl		
126	OC(O)O	n-Hex		
127	00(0)0	Me		
128	00,00	Et		
129	00(0)0	n-Pr	1	
130	00(0)0	i-Pr		
131	00(0)0	n-Bu		
132	00(0)0	i-Bu	1	
133	00(0)0	Allyl		
134	00(0)0	CH₂C≕CH		
135	00(0)0	CH=CH <sub>2</sub>		
136	00(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	[,	
137	00(0)0	CF <sub>3</sub>	1	
	100(0)0	10.3	1	

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
138	OC(O)O	CH₂CF₃		
139	OC(O)O	CH₂CN		]
140	00(0)0	Cyclopropyl		
141	00(0)0	Cyclopropylmethyl		
142	00(0)0	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		}
143	00(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
144	00(0)0	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
145	00(0)0	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
146	00(0)0	2-Furanyl		
147	00(0)0	2-Pyrimidinyl		
148	00(0)0	2-Oxazolyl	:	
149	00(0)0	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
150	00(0)0	Tetrazolyl		
151	OC(O)NR'	Н	Н	
152	OC(O)NR'	Me	H	
153	OC(O)NR'	Et	Н	
154	OC(O)NR'	n-Pr	Н	
155	OC(O)NR'	i-Pr	Н	
156	OC(O)NR'	n-Bu	Н	
157	OC(O)NR'	i-Bu	H	
158	OC(O)NR'	Allyl	Н	
159	OC(O)NR'	CH₂C≡CH	Н	
160	OC(O)NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Н	
161	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	H	
162	OC(0)NR'	CF <sub>3</sub>	H	
163	OC(0)NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	н	
164	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CN	н	[
165	OC(O)NR'	Cyclopropyl	Н	1
166	OC(0)NR'	Cyclopropylmethyl	H	
167	OC(0)NR'	CH₂CO₂Me	H	
168	OC(0)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	н	
169	OC(0)NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Н	
170	OC(O)NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Н	
171	OC(0)NR'	2-Furanyl	Н	
172	OC(0)NR'	2-Pyrimidinyl	Н	
173	OC(0)NR'	2-Oxazolyl	Н	
174	OC(0)NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	lн	
175	OC(0)NR'	Tetrazolyi	Н	
176	OC(O)NR'	H	Me	<del> </del>
177	OC(0)NR'	Me	Me	
178	OC(0)NR'	Et	Me	
179	OC(0)NR'	n-Pr	Me	
180	OC(0)NR'	i-Pr	Me	
181	OC(0)NR'	n-Bu	Me	
182	OC(0)NR'	i-Bu	Me	
183	OC(0)NR'	Allyl	Me	
184	OC(0)NR'	CH₂C≡CH	Me	
185	OC(0)NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Me	
186	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Me	
1.00	100(0)(4)(		INIE	

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
187	OC(O)NR'	CF <sub>3</sub>	Me	
188	OC(O)NR'	CH₂CF₃	Me	
189	OC(O)NR'	CH2CN	Me	
190	OC(O)NR'	Cyclopropyl	Me	
191	OC(O)NR'	Cyclopropylmethyl	Me	
192	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Me	
193	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Me	
194	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Me	
195	OC(O)NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Me	
196	OC(O)NR'	Furanyl	Me	
197	OC(0)NR'	2-Pyrimidinyl	Me	
198	OC(O)NR'	2-Oxazolyl	Me	
199	OC(O)NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
200			Me	
201	OC(O)NR'	Tetrazolyl H	Me	
1	OC(O)NR'		Et	
202	OC(O)NR'	Me	Et	
203	OC(O)NR'	Et_	Et	
204	OC(O)NR'	n-Pr	Et	
205	OC(O)NR'	i-Pr	Et	
206	OC(O)NR'	n-Bu	Et	
207	OC(O)NR'	i-Bu	Et	
208	OC(O)NR'	Allyl	Et	
209	OC(O)NR'	CH₂C≡CH	Et	
210	OC(O)NR'	CH=CH₂	Et	
211	OC(O)NR'	CH₂CH₂F	Et	
212	OC(O)NR'	CF₃	Et	
213	OC(O)NR'	CH₂CF₃	Et	
214	OC(O)NR'	CH₂CN	Et	
215	OC(O)NR'	Cyclopropyl	Et	
216	OC(O)NR'	Cyclopropylmethyl	Et	
217	OC(O)NR'	CH₂CO₂Me	Et	[
218	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Et	
219	OC(O)NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Et	
220	OC(O)NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Et	
221	OC(O)NR'	2-Furanyl	Et	
222	OC(O)NR'	2-Pyrimidinyl	Et	
223	OC(O)NR'	2-Oxazolyl	Et	
224	OC(O)NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Et	
225	OC(O)NR'	Tetrazolyl	Et	
226	OC(0)C(0)O	n-Hex		
227	0000000	Me		
228	00(0)0(0)0	Et		
229	00(0)0(0)0	n-Pr		
230	00(0)0(0)0	i-Pr		]
231	00(0)0(0)0	n-Bu		ļ
232	00(0)0(0)0	i-Bu		
233	00(0)0(0)0	Allyl	l	
234	00(0)0(0)0	CH₂C≡CH		]
235	00(0)0(0)0	CH=CH <sub>2</sub>		
	100(0)0(0)0	1011-0112		, i

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
236	OC(O)C(O)O	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F		
237	00(0)0(0)0	CF <sub>3</sub>		
238	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>		İ
239	0000000	CH <sub>2</sub> CN		
240	00(0)0(0)0	Cyclopropyl		
241	00(0)0(0)0	Cyclopropylmethyl		
242	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me		
243	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>		
244	00(0)0(0)0	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)		
245	00(0)0(0)0	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl		
246	00(0)0(0)0	2-Furanyl		į
247	0C(0)C(0)0	2-Pyrimidinyl		
248	0C(0)C(0)0	2-Oxazolyl		j
249	0C(0)C(0)0	5-[1,2,4]-oxdiazolyl		
250	0C(0)C(0)0	Tetrazolyl		
251	S(O)₂NR'	H	H	
252	S(O)₂NR'	Me	н	
253	S(O)₂NR'	Et	H	
254	S(O)₂NR'	n-Pr	H	
255	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Pr	Н	
256	S(O)₂NR'	n-Bu	H	
257	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Bu	H	Ì
258	S(O)₂NR'	Allyl	H	
259	S(O)₂NR'	•	н	
260	S(O)₂NR'	CH₂C≡CH CH=CH₂	н	
261	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	н	ļ
262	S(O)₂NR'		H	
263	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	н	
264	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> CH <sub>2</sub> CN	н	
265	S(O) <sub>2</sub> NR'	Cyclopropyl	H	
266	S(O) <sub>2</sub> NR'	Cyclopropylmethyl	H .	
267	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Н	
268	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Н	1
269	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Н	
270	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	lH	
271	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Furanyl	Н	
272	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Pyrimidinyl	H	
273	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Oxazolyl	Н	
274	S(O) <sub>2</sub> NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Н	
275	S(O) <sub>2</sub> NR'	Tetrazolyl	lн	]
276	S(O) <sub>2</sub> NR'	H	Me	
277	S(O)₂NR'	Me	Me	
278	S(O)₂NR'	Et	Me	
278	S(O)₂NR'	n-Pr	Me	
		i-Pr	Me	
280	S(O)₂NR'	1	Me	
281	S(O)₂NR'	n-Bu	Me	
282	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Bu	Me	1
283	S(O)₂NR'	Allyl	1	
284	S(O)₂NR'	CH₂C≡CH	Me	<u> </u>

Bsp. Nr.	Υ	R	R'	m.p. [°C]
285	S(O)₂NR'	CH=CH <sub>2</sub>	Ме	
286	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Me	
287	S(O)₂NR'	CF₃	Me	
288	S(O)₂NR'	CH₂CF₃	Me	
289	S(O)₂NR'	CH₂CN	Ме	
290	S(O)₂NR'	Cyclopropyl	Ме	
291	S(O)₂NR'	Cyclopropylmethyl	Me	
292	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	Me	
293	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Me	
294	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Me	
295	S(O)₂NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Ме	
296	S(O)₂NR'	2-Furanyl	Me	
297	S(O) <sub>2</sub> NR'	2-Pyrimidinyl	Me	
298	S(O)₂NR'	2-Oxazolyl	Me	
299	S(O)₂NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Ме	
300	S(O)₂NR'	Tetrazolyl	Ме	
301	S(O)₂NR'	H	Et	
302	S(O) <sub>2</sub> NR'	Me	Et	
303	S(O) <sub>2</sub> NR'	Et	Et	
304	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Pr	Et	
305	S(O)₂NR'	i-Pr	Et	
306	S(O) <sub>2</sub> NR'	n-Bu	Et	
307	S(O) <sub>2</sub> NR'	i-Bu	Et	
308	S(O) <sub>2</sub> NR'	Allyl	Et	
309	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH,C≡CH	Et	
310	S(O)₂NR'	CH=CH,	Et	
311	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> F	Et	
312	S(O) <sub>2</sub> NR'	CF <sub>3</sub>	Et	
313	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH₂CF₃	Et	
314	S(O) <sub>2</sub> NR'	CH <sub>2</sub> CN	Et	
315	S(O)₂NR'	Cyclopropyl	Et	
316	S(O) <sub>2</sub> NR'	Cyclopropylmethyl	Et .	
317	S(O)₂NR'	CH₂CO₂Me	Et	
318	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> NMe <sub>2</sub>	Et	
319	S(O)₂NR'	CH <sub>2</sub> -(N-morpholinyl)	Et	
320	S(O)₂NR'	2-Chlor-pyridin-5-yl-methyl	Et	
321	S(O)₂NR'	2-Furanyl	Et	
322	S(O)₂NR'	2-Pyrimidinyl	Et	
323	S(O)₂NR'	2-Oxazolyl	Et	
324	S(O) <sub>2</sub> NR'	5-[1,2,4]-oxdiazolyl	Et	
325	S(O)₂NR'	Tetrazolyl	Et	

- B. Formulierungsbeispiele
- a) Ein Stäubemittel wird erhalten, indem man 10 Gew.-Teile Wirkstoff und 90 Gew.-Teile Talkum als Inertstoff mischt und in einer Schlagmühle zerkleinert.
- b) Ein in Wasser leicht dispergierbares, benetzbares Pulver wird erhalten, indem man 25 Gew.-Teile Wirkstoff, 65 Gew.-Teile kaolinhaltigen Quarz als Inertstoff, 10 Gew.-Teile ligninsulfonsaures Kalium und 1 Gew.-Teil oleoylmethyltaurinsaures Natrium als Netz- und Dispergiermittel mischt und in einer Stiftmühle mahlt.
- c) Ein in Wasser leicht dispergierbares Dispersionskonzentrat stellt man her, indem man 40 Gew.-teile Wirkstoff mit 7 Gew.-Teilen eines Sulfobernsteinsäurehalbesters, 2 Gew.-Teilen eines Ligninsulfonsäure-Natriumsalzes und 51 Gew.-Teilen Wasser mischt und in einer Reibkugelmühle auf eine Feinheit von unter 5 Mikron vermahlt.
- d) Ein emulgierbares Konzentrat läßt sich herstellen aus 15 Gew.-Teilen Wirkstoff, 75 Gew.-Teilen Cyclohexan als Lösungsmittel und 10 Gew.-Teilen oxethyliertem Nonylphenol (10 EO) als Emulgator.
- e) Ein Granulat läßt sich herstellen aus 2 bis 15 Gew.-Teilen Wirkstoff und einem inerten Granulatträgermaterial wie Attapulgit, Bimsgranulat und/oder Quarzsand. Zweckmäßigerweise verwendet man eine Suspension des Spritzpulvers aus Beispiel b) mit einem Feststoffanteil von 30 % und spritzt diese auf die Oberfläche eines Attapulgitgranulats, trocknet und vermischt innig. Dabei beträgt der Gewichtsanteil des Spritzpulvers ca. 5 % und der des inerten Trägermaterials ca. 95 % des fertigen Granulats.

WO 00/35913 PCT/EP99/09684

91

### C. Biologische Beispiele

#### Beispiel 1

Angekeimte Ackerbohnen-Samen (Vicia faba) mit Keimwurzeln wurden in mit Leitungswasser gefüllte Braunglasfläschchen übertragen und anschließend mit ca. 100 schwarzen Bohnenblattläusen (Aphis fabae) belegt. Pflanzen und Blattläuse wurden dann für 5 Sekunden in eine wäßrige Lösung des zu prüfenden und formulierten Präparates getaucht. Nach dem Abtropfen wurden Pflanze und Tiere in einer Klimakammer gelagert (16 Stunden Licht/Tag, 25 °C, 40-60 % RF). Nach 3 und 6 Tagen Lagerung wurde die Wirkung des Präparates auf die Blattläuse festgestellt. Bei einer Konzentration von 300 ppm (bezogen auf den Gehalt an Wirkstoff) bewirkten die Präparate gemäß Beispiele Nr. 2/29, 2/43, 2/67, 2/6, 3/6, 3/50, 3/75 und 3/49 eine 90-100 %ige Mortalität der Blattläuse.

Die Numerierung der Verbindungen ist mit Tabelle/Nr. in der Tabelle angegeben.

### Beispiel 2

Die Blätter von 12 Reispflanzen mit einer Halmlänge von 8 cm wurden für 5 Sekunden in eine wäßrige Lösung des zu prüfenden und formulierten Präparates getaucht. Nach dem Abtropfen wurden die so behandelten Reispflanzen in eine Petrischale gelegt und mit ca. 20 Larven (L3-Stadium) der Reiszikadenart Nilaparvata lugens besetzt. Nach dem Verschließen der Petrischale wurde diese in einer Klimakammer gelagert (16 Stunden Licht/Tag, 25 °C, 40-60 % RF). Nach 6 Tagen Lagerung wurde die Mortalität der Zikadenlarven bestimmt. Bei einer Konzentration von 300 ppm (bezogen auf den Gehalt an Wirkstoff) bewirkten die Präparate gemäß Beispiele Nr. 2/97, 2/127, 2/153, 2/255, 3/50 und 3/75 eine 90-100 %ige Mortalität.

### Beispiel 3

Angekeimte Ackerbohnen-Samen (Vicia faba) mit Keimwurzeln wurden in mit Leitungswasser gefüllte Braunglasfläschchen übertragen. Vier Mililiter einer wäßrigen Lösung des zu prüfenden und formulierten Präparates wurde in das Braunglasfläschchen hineinpipettiert. Anschließend wurde die Ackerbohne mit ca. 100 schwarzen Bohnenblattläusen (Aphis fabae) stark belegt. Pflanze und Tiere wurden dann in einer Klimakammer gelagert (16 Stunden Licht/Tag, 25 °C, 40-60 % RF). Nach 3 und 6 Tagen Lagerung wurde die wurzelsystemische Wirkung des Präparates auf die Blattläuse festgestellt. Bei einer Konzentration von 30 ppm (bezogen auf den Gehalt an Wirkstoff) bewirkten die Präparate gemäß Beispiele Nr. 2/29, 2/43, 2/55, 2/67, 2/97, 2/6, 2/167, 2/153, 3/6, 3/50, 3/75 und 3/49 eine 90-100 %ige Mortalität der Blattläuse durch wurzelsystemische Wirksamkeit.

#### Patentansprüche

1. 4-Trifluormethyl-3-oxadiazolylpyridine der allgemeinen Formel (I), gegebenenfalls auch in Form der Salze,

m ist 0 oder 1;

X ist eine Einfachbindung, eine geradkettige Alkylengruppe mit 1, 2 oder 3 C-Atomen oder einer verzweigten Alkylengruppe mit 3 bis 9 C-Atomen, wobei ein oder mehrere H-Atome durch F ersetzt sein können;

Y ist -O-, -S-, -SO-, -SO<sub>2</sub>-, -O-CO-, -O-CO-O-, -SO<sub>2</sub>-O-, -O-SO<sub>2</sub>-, -NR<sup>1</sup>-, -NR<sup>2</sup>-CO-, -NR<sup>3</sup>-CO-O-, -NR<sup>4</sup>-CO-NR<sup>5</sup>-, -O-CO-CO-O-, -O-CO-NR<sup>6</sup>, -SO<sub>2</sub>-NR<sup>7</sup> oder -NR<sup>8</sup>-SO<sub>2</sub>-;

R,R<sup>1</sup>,R<sup>2</sup>,R<sup>3</sup>,R<sup>4</sup>,R<sup>5</sup>,R<sup>6</sup>,R<sup>7</sup>,R<sup>8</sup> sind gleich oder verschieden, unabhängig voneinander H,  $(C_1-C_{10})$ -Alkyl,  $(C_2-C_{10})$ -Alkenyl,  $(C_2-C_{10})$ -Alkinyl,  $(C_3-C_8)$ -Cycloalkyl,  $(C_4-C_8)$ -Cycloalkenyl,  $(C_6-C_8)$ -Cycloalkinyl, Heterocyclyl oder - $(CH_2)_{1-4}$ -Heterocyclyl,

wobei jede der acht letztgenannten Gruppen gegebenenfalls ein oder mehrfach substituiert ist, und wobei gegebenenfalls jeweils R und R<sup>1</sup>, R und R<sup>2</sup>, R und R<sup>5</sup>, R und R<sup>6</sup>, R und R<sup>7</sup>, R und R<sup>8</sup> oder R und X jeweils zusammen auch ein Ringsystem bilden können;

mit der Maßgabe, daß die Verbindungen, in denen

$$X = -, Y = O, R = H$$

$$X = -$$
,  $Y = O$ ,  $R = Me$ 

$$X = -$$
,  $Y = O$ ,  $R = Et$ 

$$X = -, Y = O, R = CHF_2$$

$$X = -$$
,  $Y = O$ ,  $R = CH2Ph$ 

$$X = CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = 2$ -Furanyl

$$X = CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = Me$ 

$$X = CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = 5$ -isoxazolyl

$$X = CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = 5$ -nitrol-furan-2-yl

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = H$ 

$$X = CH_2CH_2$$
;  $Y = O$ ,  $R = Me$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = CH_2$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = Et$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = O$ ,

$$X = CH_2CH_2$$
;  $Y = OC(O)$ ,  $R = 4-F$ -phenyl

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = OC(O)$ ,  $R = 2,6$ -Difluorphenyl

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = OC(O)$ ,  $R = 4$ -Nitrophenyl

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = OC(O)$ ,  $R = t-Bu$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = OC(O)$ ,  $R = Cyclopropyl$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = OC(O)$ ,  $R = Me$ 

$$X = CH_2CH_2CH_2$$
,  $Y = O$ ,  $R = H$ 

$$X = -$$
,  $Y = S(O)$ ,  $R = 4$ -Brombenzyl

$$X = CH_2$$
,  $Y = S$ ,  $R = Me$ 

$$X = CH_2$$
,  $Y = S(O)$ ,  $R = Me$ 

$$X = CH_2, Y = S(O)_2, R = t-Bu$$

$$X = CH_2$$
,  $Y = S$ ,  $R = 2$ -Thienyl

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = S$ ,  $R = Me$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = S$ ,  $R = n-Pr$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = S$ ,  $R = Benzyl$ 

$$X = CH_2CH_2$$
,  $Y = S$ ,  $R = 2$ -Thienyl-methyl

$$X = CH_2CH_2CH_2$$
,  $Y = S$ ,  $R = Me$ 

$$X = CH_2CH_2CH_2$$
,  $Y = SO$ ,  $R = Me$ 

 $X = CH_2CH_2CH_2CH_2$ , Y = S,  $R = CH_2CH_2CH_2CH_2OMe$  ausgenommen sind.

- 2. 4-Trifluormethyl-3-oxadiazolylpyridine nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß m in der Formel (I) 0 bedeutet.
- 3. 4-Trifluormethyl-3-oxadiazolylpyridine nach Anspruch 1 und/oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß X in der Formel (I) eine Einfachbindung, -CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-CH<sub>2</sub>-, bedeutet.
- 4. 4-Trifluormethyl-3-oxadiazolylpyridine nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 3, dadurch gekennzeichnet, daß Y in der Formel (I) -O-, -S-, -SO-, -SO<sub>2</sub>-, -O-CO-, -O-CO-O-, -O-CO-NR<sup>6</sup>-, -SO<sub>2</sub>-NR<sup>7</sup>-, -O-SO<sub>2</sub>- oder -SO<sub>2</sub>-O- bedeutet.
- 5. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der allgemeinen Formel (I) nach einem oder mehreren der Ansprüche 1 bis 4, dadurch gekennzeichnet, daß aktivierte Derivate der Säure der allgemeinen Formel (II),

in Gegenwart einer Base mit einer Verbindung der Formel (III),

$$\begin{array}{c|c}
O \\
N \\
X-Y-R
\end{array}$$
(III)

in welcher der Rest X-Y-R wie in Formel (I) definiert ist, oder eine Vorstufe eines dort definierten Restes darstellt, umgesetzt werden.

- 6. Mittel mit insektizider, akarizider und/oder nematizider Wirkung, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung nach einem der Ansprüche 1 bis 4.
- 7. Mittel mit insektizider, akarizider und nematizider Wirkung nach Anspruch 6 in Mischung mit Träger- und/oder oberflächenaktiven Stoffen.
- 8. Mittel nach Anspruch 6 oder 7, dadurch gekennzeichnet, daß es einen weiteren Wirkstoff aus der Gruppe Akarizide, Fungizide, Herbizide, Insektizide, Nematizide oder wachstumsregulierende Stoffe enthält.
- 9. Verwendung einer Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 4 oder eines Mittels nach Anspruch 6 oder 7, zur Herstellung eines Tierarzneimittels.
- 10. Verfahren zur Bekämpfung von Schadinsekten, Acarina und Nematoden, dadurch gekennzeichnet, daß man eine wirksame Menge einer Verbindung nach einem der Ansprüche 1 bis 4 oder eines Mittels nach einem der Ansprüche 6 bis 8 auf den Ort der gewünschten Wirkung appliziert.
- 11. Verfahren zum Schutz von Nutzpflanzen vor der unerwünschten Einwirkung durch Schadinsekten, Acarina und Nematoden, dadurch gekennzeichnet, daß mindestens eine der Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 4 oder ein Mittel nach einem oder mehreren der Ansprüche 6 bis 8 zur Behandlung des Nutzpflanzen-Saatgutes verwendet wird.
- 12. Verwendung von Verbindungen nach einem der Ansprüche 1 bis 4 oder eines Mittels nach einem der Ansprüche 6 bis 8 zur Bekämpfung von Schadinsekten, Acarina und Nematoden.

Internal Just Application No PCT/EP 99/09684

A. CLASSI IPC 7	FICATION OF SUBJECT MATTER C07D413/04 A01N43/836 A01N47/0	6 A01N47/10 A01N	147/28				
According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC							
	SEARCHED						
Minimum do IPC 7	ocumentation searched (classification system followed by classification CO7D A01N	on symbols)					
Documenta	tion searched other than minimum documentation to the extent that s	uch documents are included in the fields s	earched				
	ata base consulted during the international search (name of data bas	se and, where practical, search terms used	d)				
C. DOCUM	ENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT						
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the rele	evant passages	Relevant to claim No.				
P,X	WO 98 57969 A (HOECHST SCHERING A GMBH) 23 December 1998 (1998-12-2 cited in the application Tabelle 1, Verbindungen 171-174, 308, 310, 311, 352 claims 1,5-12	3)	1-12				
P,X	& DE 197 25 450 A 17 December 1998 (1998-12-17)						
А	EP 0 185 256 A (F. HOFFMANN-LA RO AG) 25 June 1986 (1986-06-25) column 21, line 35 - line 38; cla 1,13-17	•	1,6-12				
А	EP 0 580 374 A (ISHIHARA SANGYO K LTD.) 26 January 1994 (1994-01-26 cited in the application claims 1,2,12-17 	AISHA,	1,6-12				
X Furti	her documents are listed in the continuation of box C.	X Patent family members are listed	I in annex.				
Special categories of cited documents:  T" later document published after the international filing date							
consid "E" earlier of filing d	"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance invention  "E" earlier document but published on or after the international filling date  "X" document of particular relevance; the claimed invention carmot be considered novel or cannot be considered to						
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)  "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or  "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or							
other means ments, such combination being obvious to a person skilled  "P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed "&" document member of the same patent family							
Date of the actual completion of the international search  Date of mailing of the international search report							
2	1 March 2000	28/03/2000					
Name and r	mailing address of the ISA  European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  NL - 2280 HV Rijswijk	Authorized officer					
	Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo ni, Fax: (+31-70) 340-3016	Hass, C					

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1992)

International Application No
PCT/EP 99/09684

		PCT/EP 99/09684
יטת'•	ation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT	
, •	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to daim No.
	WO 95 07891 A (HOECHST SCHERING AGREVO GMBH) 23 March 1995 (1995-03-23) cited in the application claims 1,7-10,12-14,16-18	1,6-12
	DE 42 39 727 A (BAYER AG) 1 June 1994 (1994-06-01) Tabelle 2, Beispiele Nr. 20, 27-36 claims 1,4-7	6-12
	·	

information on patent family members

Internat. ..el Application No
PCT/EP 99/09684

	itent document I in search report		Publication date	1	Patent family member(s)		Publication date
WO	9857969	Α	23-12-1998	DE	19725450		17-12-1998
				AU	8624398	Α	04-01-1999
				ZA	9805180	Α	17-12-1998
EP	185256	Α	25-06-1986	AT	60594		15-02-1991
				AU	589931		26-10-1989
				AU	5148685		26-06-1986
				CA	1273342		28-08-1990
				DK EG	552685 17800		22-06-1986 30-08-1990
				ES	550205		01-10-1987
				ES	8708214		16-12-1987
				. ES	556895		16-02-1988
				ES	8801642		16-04-1988
				HU	39971		28-11-1986
				IL	77343	Α	17-09-1990
				NZ	214566		27-07-1989
				PT	81749		01-01-1986
				US	4788210		29-11-1988
				BR GR	8506390 853049		02-09-1986 22-04-1986
				JP	61152661		11-07-1986
				ZA	8509576		27-08-1986
EP	580374	Α	26-01-1994	AT	132489	T	15-01-1996
				AU	4210693		03-02-1994
				BR	9302960		16-02-1994
				CA	2100011		24-01-1994
				CN CZ	1081670 9301502		09-02-1994 16-02-1994
				DE	69301205		15-02-1996
				DE	69301205		05-09-1996
				DK	580374		20-05-1996
				EG	20154		31-07-1997
				ES		Ţ	16-05-1996
				GR HK	3018953 1001896	T	31-05-1996
				HU	68334		17-07-1998 28-06-1995
				IL	106340		12-03-1999
				JP	2994182		27-12-1999
				JP	6321903	Α	22-11-1994
				MX	9304425		28-02-1994
				PL	299769		05-04-1994
				RU	2083562		10-07-1997
				SK US	75093 5360806		08-06-1994 01-11-1994
				ZA	9305042		05-04-1994
WO	9507891	Α	23-03-1995	DE	4331179	Α	16-03-1995
				AU	7615294	Α	03-04-1995
				BR	9407541		31-12-1996
				CN	1130901		11-09-1996
				EP	0719256		03-07-1996
				JP TR	9502446 28674		11-03-1997 16-01-1997
				US	5723450	Α	03-03-1998

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (July 1992)

Information on patent family members

Interna. .ai Application No PCT/EP 99/09684

Patent document cited in search report		Publication date		atent family member(s)	Publication date	
DE 4239727	A	01-06-1994	AU WO EP JP US US	5624594 A 9412496 A 0670836 A 8504192 T 5633267 A 5756523 A	22-06-1994 09-06-1994 13-09-1995 07-05-1996 27-05-1997 26-05-1998	

Form PCT/(SA/210 (patent family annex) (July 1992)

Internat. .ales Aktenzeichen PCT/EP 99/09684

A KLACCI	STERLING DEC ANNEL DUNGSCEGENGTANDES	·					
ÎPK 7	IFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES CO7D413/04 A01N43/836 A01N47/0	6 A01N47/10 AC	01N47/28				
Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK							
	RCHIERTE GEBIETE						
	rter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbo	de )					
IPK 7	CO7D A01N	,					
Recherchie	rte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, so	weit diese unter die recherchierten Ge	biete fallen				
10/55 4							
Wallerio	er internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (N	ame der Datenbank und evti. Verwen	dete Suchbegnife)				
	SENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN						
Kategone*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe	e der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.				
Ρ,Χ	WO 98 57969 A (HOECHST SCHERING A GMBH) 23. Dezember 1998 (1998-12-in der Anmeldung erwähnt Tabelle 1, Verbindungen 171-174, 308, 310, 311, 352	23)	1-12				
Р,Х	Ansprüche 1,5-12 & DE 197 25 450 A 17. Dezember 1998 (1998-12-17)						
A	EP 0 185 256 A (F. HOFFMANN-LA RO AG) 25. Juni 1986 (1986-06-25) Spalte 21, Zeile 35 - Zeile 38; A 1,13-17		1,6-12				
А	EP 0 580 374 A (ISHIHARA SANGYO K LTD.) 26. Januar 1994 (1994-01-26 in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,2,12-17	AISHA,	1,6-12				
X Weit	lere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu	,	1				
entn	ehmen	X Siehe Anhang Patentfamilie					
<ul> <li>Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :</li> <li>"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definient, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist</li> <li>"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundellegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist</li> <li>"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung</li> </ul>							
"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhalt er- scheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt) kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden "V" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erlindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet							
"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündtliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichung dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist "&" Veröffentlichung, die Mitglied derseiben Patentlamilie ist							
Datum des Abschlusses der internationalen Recherche Absendedatum des Internationalen Recherchenberichts							
2	1. März 2000	28/03/2000					
Name und f	Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentiaan 2	Bevollmächtigter Bediensteter					
	NL - 2260 HV Rijswijk Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016  Hass, C						

Internatic alles Aktenzeichen
PCT/EP 99/09684

	rung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN		16.
Kategone°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht komme	nden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 95 07891 A (HOECHST SCHERING AGREVO GMBH) 23. März 1995 (1995-03-23) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,7-10,12-14,16-18		1,6-12
A	DE 42 39 727 A (BAYER AG) 1. Juni 1994 (1994-06-01) Tabelle 2, Beispiele Nr. 20, 27-36 Ansprüche 1,4-7		6-12
,			

MICHONIA 440 MENTER 1 -

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internatic Lies Aktenzeichen
PCT/EP 99/09684

	lecherchenberic artes Patentdoku		Datum der Veröffentlichung		fitglied(er) der Patentfamilie	Datum der Veröffentlichung
WO	9857969	Α	23-12-1998	DE	19725450 A	17-12-1998
				ΑÜ	8624398 A	04-01-1999
				ZA	9805180 A	17-12-1998
٤P	185256	Α	25-06-1986	AT	60594 T	15-02-1991
				AU	589931 B	26-10-1989
				AU	5148685 A	26-06-1986
				CA DK	1273342 A 552685 A	28-08-1990
				EG	17800 A	22-06-1986 30-08-1990
				ES	550205 D	01-10-1987
				ES	8708214 A	16-12-1987
				ES	556895 D	16-02-1988
				ES	8801642 A	16-04-1988
				HU	39971 A,B	28-11-1986
				IL	77343 A	17-09-1990
				NZ	214566 A	27-07-1989
				PT US	81749 A,B	01-01-1986
				US BR	4788210 A 8506390 A	29-11-1988
				GR	853049 A	02-09-1986 22-04-1986
				JP	61152661 A	11-07-1986
				ZA	8509576 A	27-08-1986
EP	580374	Α	26-01-1994	AT	132489 T	15-01-1996
				AU	4210693 A	03-02-1994
				BR	9302960 A	16-02-1994
				CA CN	2100011 A,C	24-01-1994
				CZ	1081670 A,B 9301502 A	09-02-1994 16-02-1994
				DE	69301205 D	15-02-1996
				DE	69301205 T	05-09-1996
				DK	580374 T	20-05-1996
				EG	20154 A	31-07-1997
				ES	2085118 T	16-05-1996
				GR HK	3018953 T 1001896 A	31-05-1996
				HN	68334 A,B	17-07-1998 28-06-1995
				ĬL	106340 A	12-03-1999
				JP	2994182 B	27-12-1999
				JP	6321903 A	22-11-1994
				MX	9304425 A	28-02-1994
				PL	299769 A	05-04-1994
				RU SK	2083562 C	10-07-1997
				US US	75093 A 5360806 A	08-06-1994 01-11-1994
				ZA	9305042 A	05-04-1994
WO	9507891	Α	23-03-1995	DE	4331179 A	16-03-1995
				AU	7615294 A	03-04-1995
				BR	9407541 A	31-12-1996
				CN	1130901 A	11-09-1996
				EP JP	0719256 A 9502446 T	03-07-1996 11-03-1997
				TR	28674 A	16-01-1997
				ÜS	5723450 A	03-03-1998
				ZA	9407040 A	02-05-1995

Formblatt PCT/ISA/210 (Anhang Patentfamilie)(Juli 1992)

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur setben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen
PCT/EP 99/09684

lm Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der	Mitglied(er) der	Datum der
	Veröffentlichung	Patentfamilie	Veröffentlichung
DE 4239727 A	01-06-1994	AU 5624594 A WO 9412496 A EP 0670836 A JP 8504192 T US 5633267 A US 5756523 A	22-06-1994 09-06-1994 13-09-1995 07-05-1996 27-05-1997 26-05-1998

Formblatt PCT/ISA/210 (Anhang Patentfamilie)(Juli 1992)